11 Veröffentlichungsnummer:

0 377 893

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(1) Anmeldenummer: 89123895.8

(1) Int. Cl.5: C07D 207/38, C07D 405/12, A01N 43/36

2 Anmeldetag: 23.12.89

Priorität: 07.01.89 DE 3900301 18.08.89 DE 3927222

- Veröffentlichungstag der Anmeldung: 18.07.90 Patentblatt 90/29
- Benannte Vertragsstaaten:
 BE CH DE ES FR GB IT LI NL

 BE CH DE ES FR GB IT LI NL
- 71 Anmelder: BAYER AG

D-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

@ Erfinder: Fischer, Reiner, Dr. Nelly-Sachs-Strasse 23 D-4019 Monhelm(DE) Erfinder: Baasner, Bernd, Dr. Wagner-Strasse 23 D-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE) Erfinder: Hagemann, Hermann, Dr. Kandinsky-Strasse 52

> D-5090 Leverkusen 1(DE) Erfinder: Krebs, Andreas, Dr.

Im Gartenfeld 70

D-5068 Odenthal-Holz(DE)

Erfinder: Marhold, Albrecht, Dr. Carl-Duisberg-Strasse 329

D-5090 Leverkusen(DE)

Erfinder: Santel, Hans-Joachim, Dr.

Grünstrasse 9a

D-5090 Leverkusen(DE)

Erfinder: Schmidt, Robert R., Dr.

Im Waldwinkel 110

D-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE)

Erfinder: Lürssen, Klaus, Dr. August-Kierspel-Strasse 145 D-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE) Erfinder: Becker, Benedikt, Dr.

Steinmannhof

I-39050 Pineta di Laives Bolzano(IT)

Erfinder: Schaller, Klaus, Dr. Am Sonnenschein 38 D-5600 Wuppertal 1(DE) Erfinder: Strang, Harry, Dr.

Heiderweg 53

D-4000 Düsseldorf 31(DE)

- (S) 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate.
- © Es werden neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I)

377 893 A

in welcher

X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R1, -CO-O-R2

steht,

wobei R¹ und R² die im Anmeldungstext angegebene Bedeutung besitzen,

- A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,
- B, C* unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Die neuen Verbindungen besitzen eine überraschende insektizide, akarizide, herbizide und antimykotische Wirksamkeit.

3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate

Die Erfindung betrifft neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Insektizide, Akarizide und Herbizide.

Von 3-Acyl-pyrrolidin-2,4-dionen sind pharmazeutische Eigenschaften vorbeschrieben (S. Suzuki et. al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)). Weiterhin wurden N-Phenyl-pyrrolidin-2,4-dione von R. Schmierer und H. Mildenberger Liebigs Ann. Chem. 1985 1095 synthetisiert. Eine biologische Wirksamkeit dieser Verbindungen wurde nicht beschrieben.

In EP-A 0 262 399 werden ähnlich strukturierte Verbindungen (3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dione) offenbart, von denen jedoch keine herbizide, insektizide oder akarizide Wirkung bekannt geworden ist.

Es wurden nun neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gefunden, die durch die Formel (I) dargestellt sind,

in welcher

15

30

40

45

20 X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R1, -CO-O-R2

steht, in welchen

für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyal-koxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,

B und C* unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Im folgenden seien die folgenden Untergruppen definiert:

(la): Verbindungen der Formel (l) worin R = Wasserstoff,

(lb): Verbindungen der Formel (l) worin R = COR1,

(Ic): Verbindungen der Formel (I) worin R = COOR².

Weiterhin wurde gefunden, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dione bzw. deren Enole der Formel (la)

in welcher A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man

(A)

N-Acylaminosäureester der Formel (II)

$$\begin{array}{c}
C^* & CO_2R^3 \\
A - N & Z_n
\end{array}$$

in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben

und

5

R3 für Alkyl steht,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert.

(B)

15 Außerdem wurde gefunden, daß man Verbindungen der Formel (Ib)

$$\begin{array}{c|c}
 & 0 \\
 & \parallel \\
 & R^1 - C - O \\
 & X \\
 &$$

25

20

in welcher A, B, C, X, Y, Z, R¹ und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formel (la),

30

$$\begin{array}{c|cccc}
C^* & HO & X \\
\hline
A & N & O
\end{array}$$

35

40

50

in welcher

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben,

a) mit Säurehalogeniden der allgemeinen Formel (III)

in welcher

R1 die oben angegebene Bedeutung hat

und

Hal für Halogen, insbesondere Chlor und Brom steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

oder

B) mit Carbonsäureanhydriden der allgemeinen Formel (IV)

R1-CO-O-CO-R1 (IV

in welcher

R¹ die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

umsetzt.

55 ((

Ferner wurde gefunden, daß man Verbindungen der Formel (lc)

$$\begin{array}{c|c}
R^{2}O-C-O & X \\
C & & & \\
\hline
C & & & \\
\hline
A & & & \\
\end{array}$$
(1c)

10 in welcher

A, B, C*, X, Y, Z, R² und n die oben angegebene Bedeutung haben, erhält, wenn man Verbindungen der Formel (la)

$$\begin{array}{c|cccc}
C^* & HO & X \\
\hline
A & N & O
\end{array}$$
(Ia)

20

35

15

in welcher

A, B, C', X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Chlorameisensäureester der allgemeinen Formel (V)

R²-O-CO-CI (V)

5 in welcher

R² die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfals in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

Überraschenderweise wurde gefunden, daß die neuen 3-Arylpyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) sich durch hervorragende insektizide, akarizide, herbizide und antimykotische Wirkungen auszeichnen.

Bevorzugt sind 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I), in welcher

X für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, Halogen, C1-C6-Alkoxy, C1-C3-Halogenalkyl steht,

Z für C1-C6-Alkyl, Halogen, C1-C6-Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R2 (Ic)

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl und Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₆-Alkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-substituiertes Phenyl;

für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₆-Alkyi, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₆-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C6-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen, Amino und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C1-C6-Alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₆-Alkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl-C₁-C₆-Haloalkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in welcher

- 5 X für C1-C4-Alkyl, Halogen, C1-C4-Alkoxy steht,
 - Y für Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, Halogen, C1-C4-Alkoxy, C1-C2-Halogenalkyl steht,
 - Z für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy steht,
 - n für eine Zahl von 0-3 steht,
 - R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel
- 10 -CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R2 (Ic)

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl und Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₄-alkyl steht,

20 für gegebenenfalls duch Halogen- und C₁-C₆-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

gegebenenfalls für durch Halogen- und C1-C4-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C5-alkyl steht,

für gegebenfalls durch Halogen, Amino und C1-C4-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C1-C5-alkyl steht,

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₁₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl steht,

²⁵ für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro-, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C_1 - C_1 0-Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_8 -Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Polyalkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_8 -Alkylthio- C_2 - C_6 -alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen-, C_1 - C_4 -Alkyl-, C_1 - C_4 -Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl- C_1 - C_4 -alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in welcher

- X für Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
- Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy. Ethoxy und Trifluormethyl steht,
- Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
- o n für eine Zahl von 0-3 steht,
 - R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

35

oder -CO-O-R² (Ic)

steht, in welcher

für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes: C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxyl-C₂-C₄-alkyl und Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor, Brom-, Methyl-, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl-, Trifluormethoxy-, Nitro- substituiertes Phenyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluor-methyl, Trifluormethoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₃-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Pyridyl, Pyrimidyl, Thiazolyl und Pyrazolyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Phenoxy-C1-C4-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Amino-, Methyl-, Ethyl-, substituiertes Pyridyloxy-C₁-C₄-alkyl, Pyrimidyloxy-C₁-C₄-alkyl und Thiazolyloxy-C₁-C₄-alkyl steht,

 R^2 für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1 - C_{14} -Alkyl, C_2 - C_{14} -Alkenyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_2 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -Polyalkoxy- C_2 - C_6 -alkyl steht,

oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Nitro, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄- alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-, Nitro susbtituiertes Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyalkyl steht,

10 sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel I.

15

20

55

Verwendet man gemäß Verfahren (A) N-2,6-Dichlorphenylacetyl-N-methyl-alaninethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

Verwendet man gemäß Verfahren (B) (Variante α) 3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-1-isopropyl-pyrrolidin-2,4-dion und Pivaloylchlorid als Ausgangsstoff, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

Verwendet man gemäß Verfahren B (Variante ß) 3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-1-cyclopentyl-pyrrolidin-2,4-dion und Acetanhydrid, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

Verwendet man gemäß Verfahren C 3-(2,4-6-Trimethylphenyl)-1-methoxyethyl-5-methyl-pyrrolidin-2,4-dion und Chlorameisensäureethoxyethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

10

5

Die bei dem obigen Verfahren (A) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (II)

15

20

in welcher

A, B, C*, X, Y, Z, n und R³ die oben angegebene Bedeutung haben sind teilweise bekannt oder lassen sich nach im Prinzip bekannten Methoden in einfacher Weise herstellen. So erhält man z.B. Acyl-aminosäureester der Formel (II), wenn man

a) Aminosäureester der Formel (VI),

30

35

in welcher

R4 für Wasserstoff (VIa) und Alkyl (VIb) steht

und

die oben angegebene Bedeutung haben mit Phenylessigsäurehalogeniden der Formel (VII) A, B und C*

45

in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und

für Chlor oder Brom steht,

acyliert (Chem. Reviews 52 237-416 (1953);

oder wenn man Acylaminosäuren der Formel (Ila),

in welcher A. B. C*, X. Y. Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und für Wasserstoff steht. R⁴ verestert (Chem. Ind. (London) 1568 (1968)). 15 Beispielhaft seien folgende Verbindungen der Formel (II) genannt: 1. N-Isopropyl-N-(2,4-Dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 2. N-Isopropyl-N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 3. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-sarkosin-methylester 4. N-Isopropyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 20 N-Methoxyethyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 6. N-Methoxyethyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 7. N-tert.-Butyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 8. N-Methyl-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 9. N-2-(2,4,4-trimethyl-pentyl)-N-(2,6-dichlorphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 25 10. N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin-methylester 11. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 12. N-Isopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 13. N-tert.-Butyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 14. N-iso-Butyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 30 15. N-sec-Butyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 16. N-neo-Pentyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 17. N-2-(2,3-Dimethyl-butyl)-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 18. N-2-(2,2,3-Trimethyl-butyl)-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 19. N-Cyclopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 35 20. N-Cyclopentyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 21. N-Cyclohexyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 22. N-Alkyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 23. N-Benzyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 24. N-2-(2,4,4-trimethyl-pentyl)-N-(2,4,6-Trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 25. N-Methoxyethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 40 26. N-Methoxypropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 27. N-Methoxy-2-methyl-propyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 28. N-2-(Ethoxy-butyl)-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 29. N-2-(Methoxy-propyl)-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 30. N-Ethyl-mercaptoethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-glycin-ethylester 45 31. N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 32. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 33. N-Isopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 34. N-IsobutyI-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 35. N-sec-Butyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 50 36. N-Cyclopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 37. N-Cyclopentyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 38. N-Cyclohexyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 39. N-Methoxyethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 40. N-Methoxypropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-alanin-ethylester 55 41. N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-buttersäure-ethylester

42. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-buttersäure-ethylester 43. N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-valeriansäure-ethylester

- 44. N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-iso-valeriansäure-ethylester
- 45. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-valeriansäure-ethylester
- 46. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-amino-iso-valeriansäure-ethylester
- 47. N-Methyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-methylalanin-ethylester
- 48. N-Ethyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-methylalanin-ethylester
- 49. N-Isopropyl-N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-2-methylalanin-ethylester

Beispielhaft sind folgende Verbindungen der Formel (IIa) genannt:

1. N-(2,4-Dichlorphenyl-acetyl)-sarkosin

5

10

20

- 2. N-(2,6-Dichlorphenyl-acetyl)-sarkosin
- 3. N-(2,4,6-trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin

Verbindungen der Formel (IIa) sind beispielsweise aus den Phenylessigsäurehalogeniden der Formel (VII) und Aminosäuren der Formel (VIa) nach Schotten-Baumann (Organikum 9, Auflage 446 (1970) VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin) erhältlich.

Verbindungen der Formel VI, in welchen A, B, C und R⁴ die oben angegebene Bedeutung haben, sind nach literaturbekannten Verfahren aus α-Halogencarbonsäuren bzw. -estern und Aminen erhältlich (Advanced Organic Chemistry, J. March S. 377, Mc Graw-Hill Inc. 1977).

Das Verfahren (A) ist dadurch gekennzeichnet, daß Verbindungen der Formel (II) in welcher A, B, C, X, Y, Z, m, n und R³ die oben angegebene Bedeutung haben in Gegenwart von Basen einer intramolekularen Kondensation unterwirft.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (A) alle üblichen inerten organischen Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Toluol und Xylol, ferner Ether, wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glylkoldimethylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare Lösungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Dimethylformamid und N-Methylpyrrolidon.

Als Deprotonierungsmittel können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) alle üblichen Protonenakzeptoren eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Alkalimetall- und Erdalkalimetall-oxide, -hydroxide und -carbonate, wie Natrlumhydroxid, Kaliumhydroxid, Magnesiumoxid, Calciumoxid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat, die auch in Gegenwart von Phasentransferkatalysatoren wie z.B. Triethylbenzylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Adogen 464 oder TDA 1 eingesetzt werden können. Ferner sind Alkalimetall- und Erdalkalimetallamide und -hydride, wie Natriumamid, Natriumhydrid und Calciumhydrid, und außerdem auch Alkalimetall-alkoholate, wie Natriummethylat und Kalium-tert.-butylat einsetzbar.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 250°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 150°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (A) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Adogen 464 = Methyltrialkyl(C₈-C₁₀)ammoniumchlorid

TDA 1 = Tris-(methoxyethoxylethyl)-amin

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) setzt man die Reaktionskomponenten der Formeln (II) und die deprotonierenden Basen im allgemeinen in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

Das Verfahren (Ba) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (Ia) mit Carbonsäurehalogeniden der Formel (III) umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren ($B\alpha$) bei Verwendung der Säurehalogenide alle gegenüber diesen Verbindungen inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüberhinaus Carbonsäureester, wie Ethylacetat, und auch stark polare Solventien, wie Dimethylsulfoxid und Sulfolan. Wenn die Hydrolysestabilität des Säurehalogenids es zuläßt, kann die Umsetzung auch in Gegenwart von Wasser durchgeführt werden.

Verwendet man die entsprechenden Carbonsäurehalogenide so kommen als Säurebindemittel bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (Βα) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, , Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicycloundecen (DBU), Diazabicyclononben (DBN), Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdal-kalimetalloxide, wie Magnesium- und Calciumoxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Ba) auch bei der Verwendung von Carbonsäurehalogeniden innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (Ba) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und das Carbonsäurehalogenid der Formel (III) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet.

Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäureanhydrid in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Das Verfahren (Bß) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (la) mit Carbonsäurehydriden der Formel (IV) umsetzt.

Verwendet man bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Bß) als Reaktionskomponente der Formel (IV) Carbonsäureanhydride, so können als Verdünnungsmittel vorzugsweise diejenigen Verdünnungsmittel verwendet werden, die auch bei der Verwendung von Säurehalogeniden vorzugsweise in Betracht kommen. Im übrigen kann auch ein im Überschuß eingesetztes Carbonsäurehydrid gleichzeitig als Verdünnungsmittel fungieren.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (Bß) auch bei der Verwendung von Carbonsäureanhydriden innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und das Carbonsäureanhydrid der Formel (IV) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Carbonsäureanhydrid in einem größeren Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Im allgemeinen geht man so vor, daß man Verdünnungsmittel und im Überschuß vorhandenes Carbonsäureanhydrid sowie die entstehende Carbonsäure durch Destillation oder durch Waschen mit einem organischen Lösungsmittel oder mit Wasser entfernt.

Das Verfahren (C) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (la) mit Chlorameisensäureestern der Formel (V) umsetzt.

Verwendet man die entsprechenden Chlorameisensäureester so kommen als Säurebindemittel bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (C) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, DABCO, DBC, DBA, Hünig-Base und N,N-Dimethyl-anilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calcium-oxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (C) bei Verwendung der Chlorameisensäureester alle gegenüber diesen Verbindungen inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenwasserstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüberhinaus Carbonsäureester, wie Ethylacetat, und auch stark polare Solventien, wie Dimethylsulfoxid und Sulfolan.

Bei Verwendung der Chlorameisensäureester als Carbonsäure-Derivate der Formel (V) können die Reaktionstemperaturen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Arbeitet man in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und eines Säurebindemittels, so liegen die Reaktionstemperaturen im allgemeinen zwischen -20°C und +100°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 50°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren (C) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) werden die Ausgangsstoffe der Formel (la) und der entsprechende (Chlorameisensäureester der Formel (V) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis zu 2 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt dann nach üblichen Methoden. Im allgemeinen geht man so vor, daß man ausgefallene Salze entfernt und das verbleibende Reaktionsgemisch durch Abziehen des Verdünnungsmittels einengt.

55

25

30

Beispiel 1:

3,9 g (0,13 Mol) Natriumhydrid (80%ig) werden in 70 ml abs. Toluol vorgelegt. Nach Zutropfen von 36,2 g (0,107 Mol) N-2,6-Dichlorphenylacetyl-N-lsopropyl-glycinethylester in 160 ml abs. Toluol, erhitzt man 6 h unter Rückfluß. Unter Eisbadkühlung werden 20 ml Ethanol zugetropft, der Ansatz im Vakuum einrotiert, der Rückstand in 1 N NaOH gelöst und das 3-(2,6-Dichlorphenyl)-1-isopropyl-pyrrolidin-2,4-dion bei 0-20 °C mit konzentrierter Salzsäure gefällt. Das Produkt wird zur Reinigung mit Chloroform ausgekocht, anschließend wird n-Hexan zugesetzt und das ausgefallene, farblose Produkt abgesaugt. Ausbeute: 25,42 g (83 % d. Theorie) Fp. >230 °C.

Beispiel 2:

25

30

5

3,42 g (15 mmol) 3-(2,4,6-Trimethylphenyl)-1-methyl-pyrrolidin-2,4-dion werden in 50 ml abs. Tetrahydrofuran (THF) suspendiert und mit 1,22 ml (15 mmol) abs. Pyridin und 2,54 ml (15 mmol) Ethyldiisopropylamin versetzt. Dazu tropft man bei 0°-10°C 1,88 ml (15 mmol) Pivaloylchlorid gelöst in 5 ml abs. THF und rührt 30 Min. nach. Der Niederschlag wird abfiltriert, die Lösung im Vakuum einrotiert und der Rückstand an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester 1:1 chromatographiert.

Durch Kristallisation aus Ether/n-Hexan erhält man 3,8 g (80,4% der Theorie) 4-(Pivaloyloxy)-3-(2,4,6-trimethylphenyl)-1-methyl-3-pyrrolin-2-on von Schmp. 75 °C.

Beispiel 3

5,18 g (20 mmol) 3-(2,4,6-trimethylphenyl)-1-isopropyl-pyrrolidin-2,4-dion werden in 70 ml tert.-Butylme-

thylether (MTB-Ether) suspendiert. Nach Zugabe von 1,63 ml (20 mmol) abs, Pyridin und 3,4 ml (20 mmol) Ethyl-diisopropylamin tropft man bei 0°C - 10°C 2,45 g (20 mmol) Chlorameisensäure-isopropylester, gelöst in 5 ml MTB-Ether, zu, rührt 30 Minuten nach, filtriert ab und rotiert ein. Der Rückstand wird an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester 1 : 1 chromatographiert. Durch Kristallisation aus n-Hexan erhält man 4,67 g (67,6% der Theorie) 4-Isopropoxy-carbonyloxy-3-(2,4,6-trimethylphenyl)-1-isopropyl-3-pyrrolin-2-on vom Schmelzpunkt 81°C.

In entsprechender Weise zu den Herstellungsbeispielen und gemäß den allgemeinen Angaben zur Herstellung erhält man die in den nachfolgenden Tabellen 1-3 formelgmäßig aufgeführten 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion(e)-Derivate der Formel (la) - (lc).

Tabelle 1

$$\begin{array}{c|cccc}
C^* & HO & X \\
\hline
A & N & O
\end{array}$$

10	Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	c*	Fp °C
	4	Cl	Cl	Н	(сн ₃) ₂ сн-	Н	н	198
15	5	Cl	н	6-C1	сн ₃ -	H	Н	230
	6	C1	н	6-C1	сн ₃ -	сн ³ -	Н	221
	7	Cl	н	6-C1	(CH ₃) ₂ CH-	сн3-	сн3-	180
20	8	Cl	н	6-C1	(CH3)3C-	н	н	> 230
	9	Cl	н	6-C1	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -	н	н	> 235
25	10	Cl	н	6-C1	(CH ₃ 0-(CH ₂) ₂ -	н	н	> 230
	11	Cl	Н	6-C1	CH3-0-(CH2)2-	н	Н	128
	12	сн3	сн3	6-CH ³	CH3-	н	H	> 230
30	13	CH3	сн3	6-CH3	CH3-	сн ₃ -	Н	> 230
	14	снз	сн3	6-CH3	CH3-	C2H5	H	210
35	15	снз	сн3	6-CH3	CH3-	С ₃ Н ₇	н	
	16	снз	CH3	6-CH ³	CH3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	
	17	CH3	сн3	6-CH3	сн ₃ -	сн3-	сн3-	
40	18	CH3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅	H	H	> 230
	19	CH3	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅	сн3-	H	227
45	20	CH3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅	C2H5-	H	184
	21	CH3	сн3	6-CH3	C2H5	C3H7-	H	
	22	CH3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅	(CH3)2CH-	H	
50	23	CH3	CH3	6-CH3	С ₂ Н ₅	сн3-	CH3-	

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 1</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	Fp °C
	24	сн3	снз	6-CH3	с ₃ н ₇	н	н	
10	25	снз	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇	сн3-	н	
	26	СНЗ	СНЗ	6-CH3	С ₃ Н ₇	C2H5-	н	
15 -	27	снз	СНЗ	6-CH3	С ₃ Н ₇	С ₃ Н ₇	H	
	28	снз	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇	(сн ₃) ₂ сн-	н	
	29	снз	снз	6-CH3	С ₃ н ₇	сн ³ -	CH3-	
20	30	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	н	H	> 220
	31	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	сн3-	н	228
	32	снз	снз	6-CH3	(СН ₃) ₂ СН-	c ₂ H ₅	н	
25	33	CH3	CH3	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	C3H7	н	
	34	СНЗ	CH3	6-CH ₃	(CH3)2CH-	(CH ₃) ₂ CH-	H	
	35	CH3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	CH3-	сн3-	
30	36	CH3	снз	6-CH3	C4H9 .	H	н	
	37	снз	CH3	6-CH ₃	C4H9	сн ³ -	H	
35	38	CH3	CH3	6-CH3	(СН ₃) ₂ СН-СН ₂ -	н	н	209
	39	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	сн3-	н	189
40	40	СН3	СН3	6-CH3	С ₂ Н ₅ СН-	н	н	262
	41	сн3	снз	6-СН _З	с ₂ н ₅ сн-	сн ₃ -	н	205

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 1</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	A	В	c*	Fp °C
	42	СНЗ	снз	6-CH3	(CH ₃) ₃ C-	н	н	> 230
10	43	сн3	снз	6-CH3	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	н	н	> 230
	44	CH3	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-сн(сн ₃)-	н	н	> 230
15	45	сн3	снз	6-CH3	(сн ₃)3с-сн(сн3)-	н	H	> 230
	46	сн3	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	н	н	> 230
	47	сн3	снз	6-CH3	CH2=CH-CH2-	н	н	212
20	48 .	CH3	снз	6-CH3	CH2=CH-CH2-	CH3-	н	
	49	CH3	сн3	6-CH3	>	н	н) 230
25	50	сн3	сн3	6-CH3	> -	сн3-	H	> 230
	51	сн3	сн3	6-CH3	>	C2H5-	н	
	52	сн3	снз	6-CH3	>	с ₃ н ₇ -	н	
30	53	CH3	снз	6-CH3	>	(сн3) 2сн-	н	
	54	снз	сн3	6-CH3	>	Сн3-	сн3-	
35	55	сн3	снз	6-CH3	<u> </u>	Н	н	> 230
40	56	снз	снз	6-CH ₃	\Box	сн3-	Н	223
45	57	снз	снз	6-CH ₃	\Box	с ₂ н ₅ -	н	
	58	снз	снз	6-СН _З	\Box	С ₃ н ₇ -	н	

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 1</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	C*	Fp °C
10	59	снз	сн3	6-CH3	\Box	(сн ₃) 2сн-	н	
15	60	CH3	CH3	6-CH ₃	\Box	сн ₃ -	сн3-	
	61	снз	снз	6-CH3	<u></u>	н	н	> 230
20	62	сн3	CH3	6-CH3	<u></u>	сн ₃ -	н	> 230
25	63	сн3	CH3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	
30	64	снз	снз	6-CH ₃	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н	
	65	сн ₃	сн ³	6-CH3	\bigcirc	(CH3)2CH-	н	
35	66	CH3	сн3	6-CH3	<u></u>	сн3-	сн ₃ -	
40	67	сн3	снз	6-CH ₃		н	н) 230
4 5	68	Сн3	снз	6-CH3	\bigcirc	сн ₃ -	н	

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 1</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	Fp °C
	69	снз	СНЗ	6-CH ₃	сн ₃ -о-(сн ₂) ₂ -	н	н	179
10	70	СНЗ	снз	6-CH3	сн ₃ -о-(сн ₂) ₂ -	сн3-	н	165
	71	CH3	снз	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)-	Н	н	220
	72	СНЗ	снз	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)-	сн3-	н	
15	73	СНЗ	снз	6-CH3	CH3-0-(CH2)3-	н	н	190
	74	снз	снз	6-CH3	сн ₃ -о-(сн ₂) ₃ -	CH3-	H	175
20	75	CH3	СНЗ	6-CH3	c ₂ H ₅ -0-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	н	н	220
	76	снз	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -о-(сн ₂) ₂ -сн(сн ₃)-	сн3-	H	
	77	снз	CH3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)-сн ₂ -	н	н	156
25	78	снз	снз	6-CH3	C2H5-S-(CH2)2-	н	н	165

Tabelle 2

	Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
15									
	79	Cl	Cl	н	(CH3) ² CH-	н	Н	CH3-	128
	80	Cl	Н	6-C1	CH3-	сн3-	H	СН ³ -	125
20	81	Cl	н	6-C1	сн ³ -	CH3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
	82	C1	н	6-C1	CH3-	CH3-	н	(CH ³) ³ C-	68
25	83	Cl	н	6-C1	(CH3)2CH-	н	н	сн ₃ -	113
	84	Cl	Н	6-C1	(CH3)SCH-	Н	H	(CH ₃) ₂ CH-	105
	85	Cl	н	6-C1	(сн ₃)2сн-	H	Н	(CH ₃) ₃ C-	122
30	86	Cl	н	6-C1	(CH ₃) ₂ CH-	Н	н	(CH3)2CH-C(CH3)2-	112
	87	Cl	н	6-C1	(CH3)3C-	н	Н	сн ₃ -	113
35	88	Cl	н	6-C1	(CH3)3C-	н	H	. (сн ₃) ₂ сн-	117
•	89	Cl	н	6-C1	(CH3)3C-	H	H	(CH3)3C-	158
	90	CH3	CH3	6-CH3	CH3-	Н	н	СН ₃ -	Öl
40	91	снз	CH3	6-CH3	сн ₃ -	н	H	(сн ₃) ₂ сн-	Öl
	92	снз	CH3	6-CH3	сн3-	н	Н	(CH3)2CH-C(CH3)2-	45
45	93	CH3	СНЗ	6-CH3	сн ₃ -	сн3-	Н	сн ₃ -	75
70	94	СН3	CH3	6-CH3	сн3-	CH3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
	95	сн3	CH3	6-CH3	сн3-	сн3-	Н	(сн ₃) ₃ с-	Öl

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	96	снз	снз	6-CH ³	сн3-	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
	97	снз	CH3	6-CH3	сн3-	сн3-	H	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	Öl
	98	СНЗ	CH3	6-CH3	сн3-	сн3-	H	сн30-сн5-с(сн3)5-	Öl
15	99	снз	CH3	6-CH3	CH3-	сн ³ -	H	C1CH2-C(CH3)2-	Öl
20	100	снз	снз	6-CH3	сн3-	сн ₃ -	H	сн ³ о сн ³	
	101	СНЗ	СНЗ	6-CH3	CH3-	сн3-	Н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
25	102	снз	снз	6-CH3	сн3-	сн3-	H	0	
	103	СНЗ	СНЗ	6-CH3	CH3-	с ₂ н ₅ -	н	сн3-	
30	104	СНЗ	CH3	6-CH3	CH3-	с ₂ н ₅ -	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
	105	CH3	снз	6-CH3	CH3-	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃)3с-	
	106	сн ₃	CH3	6-CH3	CH3-	c ₂ H ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	•
35	107	CH3	снз	6-CH3	CH3-	c ₂ H ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	108	снз	CH3	6-CH3	сн3-	C ₂ H ₅ -	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -	•
40	109	снз	СНЗ	6-CH3	сн3-	C ₂ H ₅ -	Н	c1cH2-c(cH3)2-	
	110	снз	СнЗ	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	сн ³ о сн ³	
45	111	снз	СнЗ	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	H	(CH ₃) ₂ C=CH-	
	112	СН3	снз	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ .	н	CH3	

55

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
113	снз	СН3	6-CH3	сн3-	C3H7-	н	СН3-	
114	СНЗ	снз	6-CH3	CH3-	С ₃ Н ₇ -	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
115	CH3	CH3	6-CH3	CH3-	С ₃ Н ₇ -	H	(сн ₃)3с-	
116	снз	сн ₃	6-CH3	CH3-	с ₃ н ₇ -	H	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
117	снз	снз	6-CH3	CH3-	(CH3) ^S CH-	н	сн ₃ -	
118	СНЗ	CH3	6-CH3	CH3-	(CH3)2CH-	н	(сн ₃) ₂ сн-	
119	CH3	сн ³	6-CH3	CH3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	(сн ₃)3с-	
120	снз	снз	6-CH3	сн3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
121	снз	снз	6-CH3	сн3-	сн3-	сн3-	сн ₃ -	
122	СНЗ	снз	6-CH3	сн3-	сн ³ -	сн3-	(сн ₃) ₂ сн-	
123	СНЗ	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	сн3-	(сн ₃)3с-	-
124	СНЗ	снз	6-CH3	сн3-	сн3-	сн3-	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH ₃) ₂	-
125	СНЗ	CH3	6-CH3	C_2H_5	н	Н	сн ₃ -	8
126	СНЗ	снз	6-CH3	C ₂ H ₅	н	H	(сн ₃)2сн-	
127	CH3	снз	6-CH3	C ₂ H ₅	н	Н	(сн ³) ³ с-	9
128	СНЗ	снз	6-CH3	C2H5	н	H	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH ₃) ₂	-
129	CH3	СНЗ	6-CH3	c ₂ H ₅	H	Н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
130	CH3	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅	н	H	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -	
131	сн3	CH3	6-CH3	C2H5	н	H	C1CH2-C(CH3)2-	
132	сн3	сн3	6-CH ₃	С ₂ Н ₅	н	н	сн ³ о сн ³	

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	133	сн3	СН3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	(CH3)Sc=CH-	
70	134	сн3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	°CH3	
15	135	снз	CH3	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	сн3-	н	сн ₃ -	Öl
	136	сн3	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	CH3-	н	(CH3)2CH-	
	137	снз	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅ -	CH3-	н	(CH3)3C-	Öl
20	138	СНЗ	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	CH3-	н	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH	1 ₃) ₂ -
	139	снз	CH3	6-CH ³	с ₂ н ₅ -	сн3-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	Öl
25	140	СНЗ	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн3-	Н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн	3)2-
	141	CH3	снз	6-CH3	c ₂ H ₅ -	сн3-	Н	C1CH2-C(CH3)2	•
30	142	СН3.	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн3-	н	сн ₃ о сн	3
	143	снз	снз	6-CH3	C ₂ H ₅ -	сн3-	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
35	144	снз	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ -	сн3-	н	(0CH3	
	145	снз	CH3	6-CH3	C2H5-	C2H5-	H	сн3-	
40	146	снз	СНЗ	6-CH3	C2H5-	C2H5-	H	(CH ₃) ₂ CH-	
	147	CH3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅ -	С ₂ н ₅ -	H	(CH3)3C-	
	148	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	C ₂ H ₅ -	н	(CH ₃) ₂ -CH-C(C	H ₃) ₂ -
45	149	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	C2H5-	H	(CH3)3C-CH2-	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	150	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	C2H5-	H	сн ₃ о-сн ₂ -с	(CH ₃) ₂ -
	151	CH3	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	C2H5-	H	C1CH2-C(CH	3)2-
15	152	снз	снз	6-СН ^З	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ о	:H ₃
	153	CH3	сн3	6-CH3	C2H5-	С ₂ Н ₅ -	н	(CH3)2C=CH	i-
20	154	CH ₃	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	н	СН ³	}
	155	CH3	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	С ₃ Н ₇ -	н	сн ₃ -	
25	156	CH3	снз	6-CH3	C2H5-	С ₃ н ₇ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
	157	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	С ₃ Н ₇ -	н	(CH3)3C-	
	158	CH3	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	С ₃ н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-(C(CH ₃) ₂ -
30	159	CH3	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	(сн ₃)2сн-	н	сн3-	
	160	СНЗ	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	(CH3)2CH-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
35	161	СНЗ	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ -	(CH ₃) ₂ CH-	н	(сн ₃)3с-	
	162	СНЗ	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	(сн3)2сн-	н	(сн ₃)2сн-(C(CH ₃) ₂ -
	163	СНЗ	СНЗ	6-CH3	C ₂ H ₅ -	сн ₃ -	СН ₃ -	сн3-	
40	164	СНЗ	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	сн ₃ -	СН3-	(CH ₃) ₂ CH-	
	165	CH3	СНЗ	6-CH ₃	C ₂ H ₅ -	СН3-	СН3-	(CH3)3C-	
45	166	CH ³	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅ -		CH3-	(CH ₃) ₂ CH-(C(CH ₃) ₂ -
	167	CH3	СНЗ	6-CH3	С ₃ н ₇	н	н	сн3-	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
168	СНЗ	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н	(СН ₃) ₂ СН-	
169	снз	CH ³	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н	(CH3)3C-	
170	CH3	сн3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	н	Н	(сн ₃)2-сн-с	(CH ₃) ₂ -
171	СН ^З	CH ³	6-CH3	С ₃ н ₇ -	н	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
172	СН ^З	сн3	6-CH3	C3H7-	н	н	сн ₃ о-сн ₂ -с (CH ₃) ₂ -
173	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	Н	стен2-с (сн3	2-
. 174	CH3	снз	6-CH3	с ₃ н ₇ -	н	н	сн ₃ о	CH ₃
175	снз	сн3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
176	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н	CH;	3
177	СНЗ	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн3-	Н	сн ₃ -	
178	снз	снз	6-CH3	С ₃ н ₇ -	сн3-	н	(CH3)2CH-	
179	сн ³	сн ₃	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	СН3-	н	(сн ₃)3с-	
180	сн3	CH3	6-CH3	C ₃ H ₇ -	СН3-	н	(сн ₃)2-сн-с	(CH ₃) ₂ -
181	снз	CH3	6-CH3	с ₃ н ₇ -	CH3-	н	(CH3)3C-CH2-	•
182	сн3	сн3	6-CH3	C ₃ H ₇ -	CH3-	H	сн ₃ 0-сн ₂ -с (CH ₃) ₂ -
183	CH3	CH ³	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн ³ -	н	C1CH2-C(CH3)	2-
184	CH3	сн ₃	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн ₃ -	н	CH30	:H ₃

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	185	СН3	СНЗ	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн3-	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
	186	СНЗ	сн3	6-CH ₃	С ₃ Н ₇ -	сн3-	н	(0 CH3	
15	187	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ -	
	188	снз	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	C ₂ H ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
Ω	189	снз	сн3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	C2H5-	н	(CH ₃) ₃ C-	
20	190	снз	сн3	6-CH3	с ₃ н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	(сн3)5-сн-с(сн3) ₂ -
	191	снз	CH3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃)3с-сн ₂ -	
25	192	СНЗ	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	С ₂ н ₅ -	н	сн30-сн5-с(сн3)2-
	193	снз	CH3	6-CH3	с ₃ н ₇ -	С ₂ н ₅ -	н	C1CH2-C(CH3)2	-
30	194	снз	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	С ₂ Н ₅ -	н	сн ³ 0 сн	- -
-	195	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	С ₂ Н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
35	196	снз	СНЗ	6-СН ^З	С ₃ н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	0CH ³	
	197	СНЗ	СН3	6-CH3	C3H7-	с ₃ н ₇ -	н	сн ₃ -	
40	198	CH3	CH3	6-CH3	C3H7-	с ₃ н ₇ -	Н	(СН ₃) ₂ СН-	
	199	СНЗ	СНЗ	6-CH3	C3H7-	с ₃ н ₇ -	н	(CH3)3C-	
45	200	СНЗ	CH3	6-CH3	C3H7-	С ₃ Н ₇	H	(сн ₃)2сн-с(сн ₃)2-
	201	CH3	CH ³	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	(CH3)2CH-	H	CH3-	
	202	CH3	CH ³	6-CH3	C3H7-	(CH3)2CH-	H	(CH3)2CH-	

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Beb.	x	Υ	z _n	λ	В	C*	R^1	Fp	° C
10	203	сн3	CH3	6-CH3	с ₃ н ₇ - (с	н ₃) ₂ сн-	н	(СН ₃)3С-		_
.0	204	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ H ₇ - (С	н ₃) ₂ сн-	H	(CH ₃) ₂ CH-С(CH ₃) ₂ -		
	205	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн3-	сн3-	сн ₃ -		
15	206	сн3	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн3-	СН3-	(CH ₃) ₂ CH-		
	207	сн3	сн3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	сн3-	сн3-	(CH3)3C-		
	208	CH3	снз	6-СН ^З	С ₃ н ₇ -	сн3-	сн3-	(CH3)2CH-C(CH3)2		
20	209	CH ³	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	н	н	сн ₃ -		75
	210	сн3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	(CH ₃) ₂ CH-		08
25	211	снз	снз	6-CH3	(сн ₃)2сн-	H	н	(CH ₃) ₃ C-		86
	212	CH3	СНЗ	6-CH3	(сн ₃)2сн-	H	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	1	80
	213	сн3	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -		74
30	214	CH3	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	Ħ	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -		68
	215	CH ³	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	с1СH ₂ -С(СH ₃) ₂ -	1	53
35	216	сн3	снз	6-CH3	(сн ₃)2сн-	H	Н	сн ₃ о сн ₃		
	217	СНЗ	СНЗ	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	н	Н	(сн ₃)2с=сн-		67
40	218	снз	снз	6-CH ₃	(сн ₃)2сн-	н	н	CH3		
45	219	сн3	СН3	6-СН _З	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	NO2		

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	Α	В	c*	R ¹	Fp °C
10	220	СНЗ	сн3	. 6-СН _З	(сн ₃)2сн-	н	н	NO ₂	
15	221	сн ₃	CH3	6-CH ₃	(сн ₃) ₂ сн-	н	H	02N-	
20	222	сн3	сн ₃	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	C1	
25	223	сн ₃	снз	6-CH ₃	(СН ₃) ₂ СН-	н	н	C1	
30	224	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	cı—	•
35	225	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	СH ³	
33	226	СНЗ	СНЗ	6-СН3	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	CH ³	
40	227	СНЗ	снз	6-СН _З	(сн ₃)2сн-	н	н	сн3-С	
45	228	сн3	сн3	6-СН _З	(сн ₃)2сн-	н	н	OCH3	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	229	снз	сн3	6-СН _З	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	H ₃ C0	
15	230	сн3	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	н	н	нзсо-	
	231	СНЗ	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	сн ³	н	сн3-	Öl
20	232	СНЗ	CH3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	сн3	н	(CH3) SCH-	
	233	CH3	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-	CH ³	H	(сн ³)³с-	94
	234	CH3	снз	6-CH3	(CH3)SCH-	CH3	Н	(сн ₃) ₂ -сн-с(сн ₃) ₂	-
25	235	сн3	снз	6-CH ³	(CH ₃) ₂ CH-	сн3	H	(сн ₃)3с-сн ₂ -	Öl
	236	CH ³	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	CH ³	H	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃)	2-
30	237	CH ³	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	CH ³	Н	C1CH2-C(CH3)2-	112 -
	238	снз	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	сн3	н	сн ₃ о сн ₃	
35	239	снз	сн3	6-CH3	(CH3)2CH-	СНЗ	н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
40	240	СНЗ	снз	6-СН ^З	(CH ₃) ₂ CH-	снз	н	ОСH ³	
	241	снз	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	C ₂ H ₅ -	H	сн ₃ -	
	242	снз	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	.c ₂ H ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
45	243	CH ³	СНЗ	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	C ₂ H ₅ -	H	(сн ₃)3с-	
	244	СНЗ	СНЗ	6-CH3	(CH ₃)2CH-	C2H5-	H	(CH ₃) ₂ -CH-C(CH ₃)	2-

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
	245	CH ³	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	с ₂ н ₅ -	н	(CH3)3C-CH2-	
10	246	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	C2H5-	H	сн30-сн5-с(сн	3)2-
	247	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	C2H5-	н	c1CH2-C(CH3)2	-
15	248	сн3	снз	6-CH ₃	(CH3) ² CH-	С ₂ н ₅ -	н	сн ₃ 0 сн	3
	249	CH3	снз	6-CH3	(CH3)2CH-	C2H5-	Н	(CH3)2C=CH-	
20	250	снз	снз	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	С ₂ Н ₅ -	н	0 CH3	
	251	СНЗ	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	С ₃ н ₇ -	Н	CH3-	
25	252	снз	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	с ₃ н ₇ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
	253	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₃ с-	
30	254	СНЗ	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	C3H7-	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -
	255	CH3	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH	- н	CH3~	
	256	CH3	CH3	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	(CH ₃) ₂ CH	- н	(CH ₃) ₂ CH-	
35	257	CH3	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	(CH ₃) ₂ CH	- H	(CH3)3C-	
	258	CH3	CH3	6-CH3	(сн3) 5сн-	(CH ₃) ₂ CH	- H	(CH3)2CH-C(C	H ₃) ₂ -
40	259	CH3	CH3	6-CH3	(сн3) 2сн-	сн3-	сн ₃ -	CH3-	
	260	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	сн3-	СН3-	· (сн ₃) ₂ сн-	
	261	CH3	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	сн3-	СН3-	· (СН ₃)3С-	
45	262	CH3	CH3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	СН3-	СН3∙	- (сн ₃)2сн-с(с	H ₃)2-

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	263	сн3	снз	6-CH3	С ₄ н ₉ -	н	н	сн ₃ -	
70	264	сн ³	CH3	6-CH3	C4H9-	н	н	(CH3)2CH-	
	265	CH3	снз	6-СН _З	C4H9-	н	н	(сн ₃)3с-	
15	266	СНЗ	CH3	6-CH3	C4H9-	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	
	267	сн3	CH3	6-СН _З	C4H9-	сн3-	н	сн ₃ -	
20	268	сн3	снз	6-СН ^З	C4H9-	СН3-	н	(сн ₃)2сн-	
20	269	Сн3	снз	6-CH3	C4H9-	сн3-	н	(СН ₃)3С-	
	270	сн3	сн3	6-CH3	C4H9-	сн3-	н	(CH3)2CH-C(CH3)2-	•
25	271	сн3	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- н	н	сн ₃ -	Öl
	272	сн3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- н	н	(сн ₃) ₂ сн-	Öl
•	273	снз	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- н	н	(сн ₃)3с-	<u></u> .öı
30	274	снз	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- н	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	Öl
	275	сн3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- сн ₃ -	н	сн ₃ -	73
35	276	снз	снз	6-CH ₃	(CH3)2CH-CH2	- сн ₃ -	н	(СН ₃)3С-	Öı
	277	снз	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- сн ₃ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	Öl
	278	снз	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	- сн ₃ -	н	(СН ₃) ₂ СН-С(СН ₃) ₂ -	•
40	279	сн3	снз	6-СН _З	с ₂ н ₅ сн- сн ₃	н	н	СН3-	Öı
45	280	снз	СНЗ	6-СН _З	с ₂ н ₅ сн-	н	н	(CH ₃) ₂ CH-	66

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	281	СН3	СН3	6-CH3	с ₂ н ₅ сн-	н	н	(CH ₃) ₃ C-	99
15	282	CH3	CH ³	6-CH3	С ₂ Н ₅ СН-	н	н (сн ₃) ₂ сн-с(сн	3 ² - 66
	283	снз	сн ₃	6-CH ₃	С ₂ Н ₅ СН-	сн3-	н	сн ₃ -	Öl
20	284	снз	снз	6-CH ₃	С ₂ Н ₅ СН-	сн ₃ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
25	285	CH3	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ сн-	сн3-	н	(сн ₃)3с-	100
30	286	Сн _З	СНЗ	6-CH ₃	С ₂ Н ₅ СН-	сн ₃ -	н	(сн ₃) ₂ сн-с (сн	³ 2-
	287	снз	снз	6-CH3	(CH3)3C-	н	H	(CH ₃) 2CH-	Öl
35	288	снз	снз	6-CH3	(CH3)3C-	H	н	(СН3)3C-	85
	289	снз	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₃ C-	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(C	(H ₃) ₂ - 107
	290	снз	CH3	6-CH3	(CH3)3C-CH2	- н	H	сн3-	Öl
40	291	CH3	CH3	6-CH ³	(сн3)3с-сн5.	- н	H	(сн ₃) 2сн-	
	292	СНЗ	CH3	6-CH3	(сн ₃)3с-сн ₂	- н	н	(сн ³) ³ с-	83
45	293	CH3	CH3	6-CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂	- н	н	(CH ₃) ₂ CH-C(C	:H ₃) ₂ -

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

Bsp.	x	Y	z _n	A	В	c*	R ¹	Fp °C
294	снз	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-сн(сн ₃	₃)- H	н	сн ₃ -	
295	сн3	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃	3)- H	н	(сн ₃) ₂ сн-	
296	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃	3)- H	Н	(сн ₃) ₃ с-	
297	сн3	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-CH(CH3	3)- H	н	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂	2-
298	снз	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃))- н	н	сн ₃ -	Öl
299	снз	CH3	6-CH3	(CH3)3C-CH(CH3)- н	н	(сн ₃) ₂ сн-	
300	снз	CH3	6-CH3	(CH3)3C-CH(CH3)- H	Н	(CH3)3C-	92
301	CH3	CH3	6-CH3	(CH3)3C-CH(CH3)- н	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	2-
302	CH3	сн3	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	н	сн ₃ -	Öl
303	СНЗ	CH3	6-CH3	CH2=CH-CH2-	н	н	(сн ₃) ₂ сн-	
304	снз	CH3	6-CH3	CH2=CH-CH2-	н	н	(CH3)3C-	Öl
305	CH3	снз	6-CH3	CH2=CH-CH2-	н	н	(СН3)2СН-С(СН3)2	2-
306	CH3	CH3	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	сн3-	Ĥ	СН3-	
307	снз	СНЗ	6-CH3	CH2=CH-CH2-	сн3-	Н	(сн ₃)2сн-	
308	CH3	CH3	6-CH3	CH2=CH-CH2-	CH3-	Н	(CH3)3C-	
309	CH3	снз	6-CH3	CH2=CH-CH2-	СН3-	н	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂	2*
310	CH3	CH3	6-CH3	>	н	н	сн ₃ -	Öl
311	CH3	СНЗ	6-CH3	>	н	н	(CH3)2CH-	35
312	СНЗ	снз	6-CH3	> —	н	н	(CH ₃) ₃ C-	75
313	СНЗ	CH3	6-CH3	>	H	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	2-

50

Tabelle 2 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	×	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
	314	сн3	CH3	6-CH ₃	>	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн	2-
10	315	CH3	СНЗ	6-CH3	> -	н	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(CH ₃) ₂ -
	316	сн3	сн3	6-CH3	> -	н	н	C1CH2-C(CH	3 2 -
15	317	сн3	снз	6-CH3	>	н	н	сн ³ о	⊂ сн ₃
	318	CH3	CH3	6-CH3	>	н	н	(сн3)2с=сн	-
20	319	CH3	CH3	6-CH3	>	н	н		H ₃
25	320	CH3	CH3	6-CH3	>	CH3	Н	CH3-	83
	321	CH3	CH3	6-CH3	>	CH3	н	(CH3)SC	н-
	322	СНЗ	CH3	6-CH3	>	CH3	н	(сн ₃)3с	- Öl
30	323	CH3	СНЗ	6-CH3	>	сн3	н	(CH ₃) ₂ -CH-C	(CH ₃) ₂ -
	324	CH3	CH3	6-CH3	>	сн3	Н	(сн ₃)3с-	сн ₂ - ö1
35	325	CH3	CH3	6-CH3	>	CH ³	Н	сн ₃ о-сн ₂ -	с(сн ₃) ₂ -
	326	CH3	CH3	6-CH3	> —	CH ³	н	C1CH2-C(сн ₃) ₂ -
40	327	CH3	СНЗ	6-CH3	>	СНЗ	н	сн ₃ о√	, Сн³
	328	CH3	CH3	6-CH3	> -	CH3	H	(CH ₃) ₂ C=	
45	329	СНЗ	снз	6-CH3	>	сн3	H	$\langle \sum \rangle$	CH3

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
40	330	СНЗ	СНЗ	6-CH3	>	С ₂ Н ₅ -	н	СН3-	
10	331	СНЗ	CH3	6-CH3	>	С ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
	332	СНЗ	CH3	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	H	(сн ³)³с-	
15	333	снз	CH3	6-CH3	>	C ₂ H ₅ -	H	(СН3)2-СН-С(СН	3 ⁾ 2 ⁻
	334	CH3	CH ³	6-CH3	>	С ₂ Н ₅ -	н	(СН ₃) ₃ С-СН ₂	•
20	365	сн3	сн3	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	Н	сн ₃ 0-сн ₂ -с (сн	3 ⁾ 2 ⁻
20	336	CH3	сн3	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	H	сісн2-с(сн3)	2-
25	337	сн3	сн3	6-сн3	>	с ₂ н ₅ -	н	сн ³ 0 сн	¹ 3
	338	CH3	сн3	6-CH3	>	С ₂ Н ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ C=CH-	
30	339	сн3	сн3	6-СН ³	>	С ₂ Н ₅ -	н	ОСH ³	
	340	CH3	СН	3 6-СН ₃	>	C3H7-	н	сн ₃ -	
35	341	CH3	СН	₃ 6-СН ₃	>	С ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
	342	CH3	СН	3 6-СН _З	D —	С ₃ н ₇ -	H	(CH3)3C-	
40	343	CH3	CH	3 6-СН _З	>	С ₃ н ₇ -	H	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃	2-
40	344	CH3	СН	6-CH3	>	(CH ₃) ₂ CH-	H	сн3-	
	345	CH3	СН	6-CH3	>	(CH ₃) ₂ CH-	H	(CH ₃) ₂ CH-	
45	346	CH3	СН	6-CH ₃	>	(CH ₃) ₂ CH-	H	(CH3)3C-	
	347	CH3	CH	3 6-СН _З	>	(CH ₃) ₂ CH-	H	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃)	2-

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
348	снз	СН3	6-CH3	>	сн3-	сн3-	сн ₃ -	
349	CH3	CH3	6-CH3	D —	CH3-	сн3-	(CH3)2CH-	
350	CH3	CH3	6-CH3	> —	сн3-	сн3-	(CH3)3C-	
351	CH3	CH3	6-CH3	>	CH3-	сн3-	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃)	2-
352	сн3	сн3	6-CH3	\Box	н	н	сн3-	60
353	снз	сн3	6-CH ₃	\Box	н	н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
354	CH3	снз	6-CH3	\Box	н	н	(CH3)3C-	80
355	сн3	сн3	6-CH3	\bigcirc	н	H (сн ₃) ₂ -сн-с(сн ₃) ₂	- 85
356	СН3	CH3	6-CH3	\bigcirc	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	74
357	CH3	CH3	6-СН _З	\Box	н	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с(сн ₃);	2-
358	CH3	СН3	6-CH3	\Box	н	н	C1CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	94
359	CH3	снз	6-CH3	\Box	н	н	сн30 сн3	39

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	×	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	360	сн ₃	CH3	6-СН _З	\Box	н	н	(СН3)2С=СН-	Öı
15	361	СН3	CH3	6-СН ³	\Box	н	н	0CH3	
	362	СН3	снз	6-CH3		сн ₃ -	н	сн3-	96
20	363	снз	CH3	6-CH3	\Box	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	Ö1
25	364	снз	снз	6-сн ₃	\Box	сн3-	н	(CH3)3C-	63
30	365	снз	СНЗ	6-сн3	\Box	сн3-	н (сн ₃) ₂ сн-с (сн ₃)	2 ⁻ Ö1
35	366	СНЗ	CH ₃	6-CH3	\bigcirc	сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	367	СНЗ	СНЗ	6-CH3	\Box	сн3-	н	сн ₃ о-сн ₂ -с (сн ₃) ₂ -
40	368	СНЗ	CH3	6-CH3	\Box	сн3-	H	с1СH ₂ -с(СH ₃) ₂	·
45	369	Сн3	СНЗ	6-CH ₃	\Box	сн3-	н	сн ₃ о сн	3

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	370	сн3	сн3	6-CH3	\Box	сн ₃ -	н	(CH ₃) ₂ C=C	н-
15	371	снз	сн3	6-CH3	\Box	СН ₃ -	н		сн ₃
	372	снз	снз	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	сн3-	
20	373	снз	CH3	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ C	н-
25	374	снз	CH3	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(CH ₃)30	· -
30	375	снз	сн3	6-СН ^З	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ -сн-с	(CH ₃) ₂ -
35	376	сн ₃	сн3	6-сн3	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(CH ₃)3C-	-сн ₂ -
	377	сн3	сн3	6-сн3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ 0-сн ₂ -с	:(CH ₃) ₂ -
40	378	снз	снз	6-СН _З	\Box	с ₂ н ₅ -	н	C1CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
45	379	CH3	СН3	6-CH3	\bigcirc	С ₂ н ₅ -	н	сн ₃ о√	Сн3

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	A	В	c*	R ¹	Fp °C
10	380	снз	сн ₃	6-CH3	\Box	С ₂ Н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ с=сн	
15	381	снз	СНЗ	6-CH ₃	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	$\langle \rangle \langle \rangle$	н3
	382	снз	CH3	6-CH3	\bigcirc	С ₃ н ₇ -	. Н	сн3-	
20	383	снз	снз	6-CH ³	\Box	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
25	384	снз	снз	6-CH3	\Box	с ₃ н ₇ -	н	(CH ₃) ₃ C-	
30	385	CH3	снз	6-CH3	\bigcirc	С ₃ Н ₇ -	н ((сн ₃) ₂ сн-с(с	H ₃) ₂ -
35	386	СНЗ	сн3	6-СН _З		(сн ₃) ₂ сн-	Н	сн ₃ -	
	387	CH3	СН3	6-сн3		(сн ₃) ₂ сн-	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
40	388	СН3	снз	6-СН3		(сн ₃) ₂ сн-	н	(CH3)3C-	
45	389	сн3	сн3	6-CH3		(сн ₃) ₂ сн-	- Н ((СН ₃)2СН-С (С	'H ₃) ₂ -

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c *	R ¹	Fp °C
10	390	снз	снз	6-СН ^З	\Box	сн3-	сн3-	сн ₃ -	
15	391	сн3	сн3	6-CH3	\Box	сн ₃ -	сн3-	(сн ₃) 2сн-	
15	392	CH3	сн3	6-CH3	\Box	сн3-	сн3-	(сн ₃)3с-	
20	393	снз	сн3	6-CH3	\Box	сн3-	сн3-	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃)) ₂ -
25	394	сн3	сн3	6-CH3	<u></u>	н	н	сн ₃ -	78
30	395	сн3	сн3	6-CH3	<u></u>	н	н	(сн ₃) ₂ сн-	Öl
	396	CH3	снз	6-СН _З	\bigcirc	н	н	(сн ₃) ₃ с-	97
35	397	CH3	СН3	6-CH3	<u></u>	н	н	(сн ₃)2сн-с(сн ₃)	2- 122
40	398	сн3	снз	6-CH3	<u></u>	н	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
45	399	сн3	сн3	6-CH3	<u></u>	н	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	400	СН3	сн3	6-CH ₃	<u></u>	н	н	сісн ₂ -с(сн ₃)2	-
15	401	CH3	сн3	6-CH3	\bigcirc	н	н	сн ₃ о сн	3
	402	сн3	снз	6-СН ^З	\bigcirc	н	н	(сн ₃)2с=сн-	
20	403	сн3	сн3	6-СН _З	<u></u>	н	н	ОСH ³	
25	404	сн3	СНЗ	6-CH3	<u></u>	сн3-	н	Сн3-	84
30	405	сн ₃	CH3	6-СН3	\bigcirc	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
35	406	снз	CH3	6-CH ₃	\bigcirc	сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-	72
	407	сн3	снз	6-СН ^З	\bigcirc	СН3-	н (сн ₃) ₂ -сн-с(сн ₃)2-
40	408	сн3	снз	6-СН _З	\bigcirc	сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	118
45	409	CH3	снз	6-CH3	<u></u>	сн3-	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃)2-

50

Tabelle 2 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹ Fp °C
10	410	снз	снз	6-CH3	\bigcirc	сн ₃ -	н	с1CH ₂ -с(CH ₃) ₂ - 115
15	411	снз	снз	6-CH3	\bigcirc	сн3-	н	сн ₃ о сн ₃
	412	снз	снз	6-CH3	<u></u>	сн3-	н	(CH ₃) ₂ C=CH-
20	413	снз	сн3	6-CH3	<u></u>	сн ₃ -	н	<0 → CH ₃
25	414	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ -
30	415	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ сн-
35	416	CH3	CH3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅	н	(сн ₃) ₃ с-
	417	сн3	CH3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -
40	418	сн3	снз	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(CH3)3C-CH ² -
45	419	сн3	CH3	6-CH ₃	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ о-сн ₂ -с(сн ₃) ₂ -

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	420	снз	снз	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	C1CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	
15	421	сн3	сн3	6-CH ₃	<u></u>	с ₂ н ₅ -	H	сн ₃ о сн	3
20	422	CH3	CH3	6-CH3	<u></u>	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃)2с=сн-	
20	423	снз	сн3	6-CH3	<u></u>	с ₂ н ₅ -	н	ОСH ³	
25	424	снз	CH ³	6-CH ₃	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	H	сн ₃ -	
30	425	СНЗ	CH ³	6-CH ₃	<u></u>	С ₃ Н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-	
35	426	снз	снз	6-СН ^З	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃)3с-	
40	427	Сн3	сн3	6-CH3	\bigcirc	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-с (сн ₃)	2-
***	428	CH3	сн3	6-CH3	<u></u>	(CH ₃)2CH-	Н	сн ₃ -	
45	429	СН3	CH ³	6-СН ^З	\bigcirc	(сн ₃) ₂ сн-	. н	(СН ₃)2СН-	

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	430	сн3	сн3	6-СН3	<u></u>	(сн ₃)2	сн- н	(CH ³) ³ C-	
15	431	CH3	сн3	6-CH3	\bigcirc	(CH3) 5	сн- н	(CH ₃) ₂ CH-C	(CH ₃) ₂ -
	432	CH ³	сн3	6-CH3	\bigcirc	сн3-	СН ₃ -	сн ₃ -	
20	433	СН3	сн3	6-CH3	\bigcirc	сн ₃ -	СН3-	(CH3) ² CH-	
25	434	сн3	сн3	6-СН3	\bigcirc	сн ₃ -	сн3-	(сн ₃) ₃ с-	
30	435	сн3	сн3	6-CH3	<u></u>	сн ₃ -	СН3-	(сн ₃) ₂ сн-с	(CH ₃) ₂ -
35	436	сн3	снз	6-CH3		Н	н	сн ₃ -	Öı
	437	сн3	сн3	6-CH3		н	н	(CH ₃) ₂ CH	-
40	438	СНЗ	снз	6-СН ^З		н	н	(CH3)3C-	104
45	439	сн3	сн3	6-СН3		н	н ((CH ₃) ₂ -CH-C(CH ₃)2-

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp Nr.	. x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp ⁰ C
	440	сн3	снз	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)	- н	н	сн ₃ -	76
10	441	сн3	CH3	6-CH ³	CH3-0-CH5-CH(CH3)	- н	H	(CH ₃) ₂ CH-	
	442	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)	- H	Н	(сн ₃)3с-	Öl
15	443	СНЗ	CH3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃	- H	H	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂	-
	444	СНЗ	CH3	6-CH ³	сн ₃ о-(сн ₂) ₂ -	н	н	сн ₃ -	Öl
	445	сн3	снз	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₂ -	н	н	(СН ₃) ₂ СН-	Öl
20	446	снз	СНЗ	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₂ -	Н	н	(CH3)3C-	Öl
	447	CH3	СнЗ	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₂ -	н	н	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂ -	Öl
25	448	снз	СНЗ	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₂ -	сн3-	н	сн ₃ -	Öl
	449	Сн3	CH3	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₂ -	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
	450	СНЗ	CH3	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₂ -	СН3-	н	(CH3)3C-	Öl
30	451	снз	CH3	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₂ -	сн3-	н	(сн ₃) ₂ сн-с(сн ₃) ₂ -	Öl
	452	снз	СНЗ	6-CH3	сн ₃ о-(сн ₂) ₃ -	н	Н	сн ₃ -	Öl
35	453	CH3	снз	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₃ -	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
00	454	CH3	СНЗ	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₃ -	н	н	(CH3)3C-	Öl
	455	сн ₃	СНЗ	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂)3-	н	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂ -	Öl
40	456	сн3	СНЗ	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₃ -	сн3-	н	снз-	Öl
	457	CH3	снз	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₃ -	СН3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
45	458	CH ₃	CH3	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₃ -	СН3-	н	(сн ₃)3с-	Öı
45	459	CH3	CH3	6-CH3	сн ₃ 0-(сн ₂) ₃ -	СН3-	н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	- Ö1

50

<u>Tabelle 2</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.)	<u>. </u>	Y	z _n	λ		В	c*	R ¹ F	Fp °C
	460 C	łз	CH3	6-CH3	с2н50-(сн2	.)2-CH(CH3)-	н	н	СН ₃ -	Öl
10	461 Ci	43	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ о-(сн ₂	, S-сн(сн ³)-	H	H	(CH3)SCH-	Öl
	462 CI	H3	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ 0-(сн ₂	2)2-CH(CH3)-	н	H	(CH3)3C-	Öl
15	463 CI	H3	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ 0-(сн ₂	2)2-сн(сн3)-	н	H	(CH3)5CH-C(CH3)5.	- Öı
	464 CI	Нз	снз	6-CH3	сн30-сн2-0	CH(CH3)-CH-	н	н	сн ₃ -	Öl
	465 CI	Н3	СНЗ	6-CH3	сн30-сн2-0	:н(сн ₃)-сн-	Н	Н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
20	466 CI	Н3	снз	6-CH ³	сн30-сн2-0	сн(сн ₃)-сн-	H	н	(CH3)3C-	Öl
	467 CI	Нз	снз	6-CH3	сн ₃ о-сн ₂ -с	сн(сн ₃)-сн-	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	- Ö1
25	468 C	НЗ	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -s-	(CH ₂) ₂ -	Н	Н	сн ₃ -	Öl
	469 C	НЗ	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ -s-	(CH ₂) ₂ -	Н	н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
	470 C	Н3	снз	6-CH ₃	C2H5-S-	(CH ₂) ₂ -	Н	н	(сн ₃)3с-	Öl
30	471 C	НЗ	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -5-	(CH ₂) ₂ -	Н	H	(CH ₃) ₂ CH-C(CH ₃) ₂	- Öl

Tabelle 3

15	Bsp. Nr.	x	Y	2 _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
	472	снз	CH ³	6-СН ^З	сн3-	н	н	сн3-	
20	473	CH3	снз	6-CH3	сн3-	н	н	C ₂ H ₅ -	
	474	CH3	снз	6-CH3	сн3-	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
	475	CH3	CH3	6-CH3	сн3-	н	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
25	476	снз	сн3	6-CH3	сн ₃ -	н	н	с ₂ н ₅ сн-	
30	477	снз	снз	6-CH3	сн3-	н	н	(CH ₃)3C-CH ₂ -	
	478	CH3	снз	6-СН _З	сн3-	н	н	\bigcirc	
35	479	снз	сн3	6-сн ₃	сн3-	н	н	\bigcirc	
40	480	снз	снз	6-CH3	СН3-	сн ₃ -	н	сн ₃ -	
	481	CH3	снз	6-CH3	сн3-	сн3-	н	с ₂ н ₅ -	Öl
45	482	снз	СНЗ	6-CH3	сн3-	сн3-	H	(сн ₃)2сн-	Öl
70	483	снз	сн3	6-CH3	сн3-	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	Öl

50

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	A	В	C*	Ř ¹	Fp °C
10	484	снз	снз	6-CH ₃	сн ₃ -	сн ₃ -	н	С ₂ Н ₅ СН-	Öl
	485	CH3	сн3	6-СН3	сн3-	сн3-	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	146
15	486	снз	CH3	6-СН ^З	сн3-	сн3-	н	\bigcirc	
20	487	сн3	сн3	6-СН _З	сн ₃ -	сн ₃ -	н		
	488	CH3	снз	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	сн3-	
25	489	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	С ₂ Н ₅ -	
	490	CH3	СНЗ	6-CH ³	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
	491	снз	CH3	6-CH3	сн3-	С ₂ Н ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
30	492	сн3	CH3	6-CH3	сн3-	С ₂ Н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
35	493	СНЗ	снз	6-CH3	CH3-	с ₂ н ₅ -	н	(CH3)3C-CH ² -	
	494	CH3	снз	6-СН ^З	сн3-	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
40	495	сн3	сн3	6-CH3	сн3-	с ₂ н ₅ -	н		
45	496	CH ₃	СНЗ	6-СН _З	CH3-	С ₃ Н ₇ -	н	с ₂ н ₅ -	
	497	CH3	CH3	6-CH ₃	сн3-	C3H7-	н	(CH ₃) ₂ CH-	

50

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
	498	CH3	снз	6-CH3	сн3-	C ₃ H ₇ -	н	(сн ₃)2сн-сн ₂ -	
10	499	Сн3	сн3	6-CH3	сн ₃ -	С ₃ Н ₇ -	H	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
45	500	СНЗ	СНЗ	6-CH3	СН3-	(CH3)2CH-	н	(CH3)3C-CH2-	
15	501	снз	снз	6-CH3	сн3-	(сн ₃)2сн-	н	С ₂ Н ₅ -	
	502	снз	CH ³	6-CH3	сн3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	(CH3) ² CH-	
20	503	сн3	CH3	6-CH3	СН3-	(сн ₃) ₂ сн-	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
	504	сн3	снз	6-CH3	СН3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	сн ₃ сн-	
25	505	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн3-	(CH ₃) ₂ CH-	н	(сн ³) ³ с-сн ⁵ -	•
	506	CH3	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	сн3-	
30	507	СНЗ	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	с ₂ н ₅ -	
	508	СНЗ	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	н	н	(CH3)2CH-	Öl
	509	CH3	снз	6-CH3	C2H5-	н	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
35	510	снз	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	н	н	с ₂ н ₅ сн-	
40	511	снз	СНЗ	6-CH3	C ₂ H ₅ -	H	н	(сн ₃)3с-сн ₂ -	
40	512	снз	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ -	н	н	\bigcirc	
45	513	СНЗ	CH3	6-СН _З	с ₂ н ₅ -	н	н	<u></u>	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	F
514	снз	снз	6-СН ^З	c ₂ H ₅ -	сн ₃ -	н	сн ₃ -	
515	снз	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн ³ -	н	c ₂ H ₅ -	
516	снз	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
517	CH3	сн3	6-CH3	C2H5-	сн3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
518	сн3	сн3	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	сн ₃ -	н	С ₂ Н ₅ СН-	
519	CH3	сн3	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	сн3-	Н	(CH3)3C-CH2-	
520	снз	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	сн3-	н	\bigcirc	
521	снз	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	сн ₃ -	н		
522	СНЗ	CH ³	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	C ₂ H ₅ -	н	сн ₃ -	
523	сн3	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	c ₂ H ₅ -	Н	с ₂ н ₅ -	
524	снз	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	С ₂ Н ₅ -	Н	(CH3)SCH-	
525	CH3	CH3	6-CH3	C2H5-	С ₂ Н ₅ -	н	(CH3)2CH-CH2	-
526	снз	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₂ н ₅ -	н	С ₂ Н ₅ СН ₃	
527	CH3	CH3	6-CH3	C ₂ H ₅ -	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂	-
528	CH3	CH3	6-CH ₃	с ₂ н ₅ -	С ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
529	снз	Сн3	6-СН _З	^C 2 ^H 5-	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
530	CH3	СНЗ	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	с ₃ н ₇ -	H	с ₂ н ₅ -	
531	СН ^З	CH ³	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₃ н ₇ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
532	снз	CH3	6-CH ³	с ₂ н ₅ -	С ₃ Н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
533	сн3	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ -	с ₃ н ₇ -	н	сн ₃ сн-	
534	сн ³	CH3	6-CH3	с ₂ н ₅ -	(CH3)2CH-	Н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
535	CH ³	CH ³	6-CH ³	с ₂ н ₅ -	(CH ₃) ₂ CH-	Н	c _z H ₅ -	
536	снз	CH3	6-CH3	С ₂ н ₅ -	(CH ₃) ₂ CH-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
537	CH3	CH ³	6-CH3	с ₂ н ₅ -	(CH3)2CH-	н	(CH3)2CH-CH2-	
538	снз	снз	6-СН ^З	с ₂ н ₅ -	(сн ₃) ₂ сн-	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
539	CH3	снз	6-CH3	C2H5-	(сн ₃) 2сн-	н	(CH3)3C-CH2-	
540	CH3	сн3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	Н	сн ₃ -	
541	CH3	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	H	C2H5-	
542	CH ³	снз	6-CH3.	с ₃ н ₇ -	H	н	(CH ₃) ₂ CH-	
543	сн ³	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	H	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
544	сн3	сн3	6-CH ₃	С ₃ Н ₇ -	н	н	с ₂ н ₅ сн-	

EP 0 377 893 A2

Tabelle 3 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
	545	сн3	сн3	6-CH ₃	с ₃ н ₇ -	н	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
10	546	сн3	сн3	6-CH3	с ₃ н ₇ -	н	н	\bigcirc	
15	547	сн3	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	н	н		
20	548	снз	снз	6-СН _З	C3H7-	сн ₃ -	н	сн ₃ -	
	549	снз	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇	CH3-	н	C ₂ H ₅ -	
	550	CH ³	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн ₃ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
25	551	CH ³	CH ³	6-CH3	C3H7-	сн3-	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
30	552	СНЗ	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	сн ₃ -	н	с ₂ н ₅ сн-	-
30	553	CH3	сн3	6-CH3	с ₃ н ₇ -	сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
35	554	CH3	сн3	6-сн3	с ₂ н ₅ -	сн3-	н	\bigcirc	
40	555	сн3	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ -	сн3-	н	\bigcirc	
	556	CH3	CH3	6-CH ₃	С ₃ Н ₇ -	C ₂ H ₅	н	СН ₃ -	
	557	CH3	CH3	6-CH ₃	С ₃ н ₇ -	C ₂ H ₅ -	н	С ₂ Н ₅ -	
45	558	CH3	СНЗ	6-CH ₃	С ₃ Н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н		

Tabelle 3 (Fortsetzung)

					-			
Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹ F	op °C
559	CH ³	CH ³	6-CH ³	С ₃ н ₇ -	C ₂ H ₅ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
560	СНЗ	СНЗ	6-СН _З	с ₃ н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	С ₂ н ₅ Сн-	
561	снз	снз	6-CH3	C3H7-	c ₂ H ₅ -	Н	(СН ₃) ₃ С-СН ₂ -	
562	снз	CH3	6-CH3	с ₃ н ₇ -	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
563	сн3	сн3	6-CH ³	С ₃ Н ₇ -	с ₂ н ₅ -	H	<u></u>	
564	сн ₃	CH3	6-CH3	С ₃ н ₇ -	С ₃ Н ₇ -	н	c ₂ H ₅ -	
565	CH3	сн3	6-CH3	C3H7-	С ₃ Н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
566	снз	снз	6-CH3	C3H7-	С ₃ Н ₇ -	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
567	снз	снз	6-СН _З	с ₃ н ₇ -	с ₃ н ₇ -	н	сн ₃ сн-	
568	CH3	снз	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	с ₃ н ₇ -	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
569	CH3	снз	6-CH3	C3H7-	(CH ₃) ₂ CH-	H	C ₂ H ₅ -	
570	CH3	СНЗ	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	(CH3)5CH-	Н	(сн ₃)2сн-	
571	сн3	CH3	6-CH3	С ₃ Н ₇ -	(CH3)2CH-	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
572	сн3	снз	6-CH3	с ₃ н ₇ -	(CH ₃) ₂ CH-	H	CH ₃ CH-	
573	CH3	CH3	6-CH3	C3H7-	(CH ₃) ₂ CH-	H	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	

55

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
574	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	н	н	сн3-	67
575	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	H	c ₂ H ₅ -	87
576	CH3	СНЗ	6-CH3	(сн3) 2сн-	Н	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	41
577	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	с ₂ н ₅ сн-	83
578	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	н	н	(сн ₃) 3с-сн ₂ -	Öl
579	сн3	снз	6-CH ₃	(сн ₃)2сн-	н	Н	\bigcirc	
580	снз	сн3	6-CH ₃	(CH ₃)2CH-	сн3-	н	сн ₃ -	
581	снз	снз	6-CH ₃	(сн ₃) 2сн-	СН3-	Н	C2H5-	
582	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
583	сн3	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
584	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	сн ₃ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
585	снз	снз	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	сн ₃ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	83
586	снз	сн ₃	6-CH ₃	(сн ₃) ₂ сн-	СН3-	н	\bigcirc	
587	сн3	CH3	6-CH ₃	(сн ₃)2сн-	сн3-	Н		

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	X	Y	z _n	A	В	c*	R ¹	Fp °C
10	588	сн3	снз	6-CH3	(сн ₃)2сн-	с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ -	
70	589	сн3	снз	6-CH3	(CH3)SCH-	с ₂ н ₅ -	H	с ₂ н ₅ -	
	590	СНЗ	СНЗ	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	С ₂ Н ₅ -	H	(сн ₃) ₂ сн-	
15	591	СНЗ	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-	с ₂ н ₅ -	Н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
	592	сн3	сн ₃	6-CH ₃	(сн ₃) ₂ сн-	с ₂ н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
20	593	сн3	СНЗ	6-CH3	(сн ₃)2сн-	С ₂ Н ₅ -	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
25	594	CH3	снз	6-сн3	(CH ₃) ₂ CH-	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
	595	сн3	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	с ₂ н ₅ -	Н		
30	596	снз	снз	6-CH3	(сн ₃)2сн-	с ₃ н ₇ -	н	С ₂ Н ₅ -	•
	597	сн3	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-	С ₃ н ₇ -	Н	(CH ₃)2CH-	
35	598	снз	CH3	6-CH3	(сн ₃) 2сн-	С ₃ Н ₇ -	Н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
40	599	СНЗ	снз	6-CH3	(сн ₃)2сн-	С ₃ н ₇ -	H	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
40	600	CH3	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-	с ₃ н ₇ -	Н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
	601	СНЗ	СНЗ	6-CH3	(CH3)2CH-	(CH ₃) ₂ CH-	н	с ₂ н ₅ -	
45	602	CH3	снз	6-CH ₃	(CH3)2CH-	(сн ₃)2сн-	н	(CH ₃) ₂ CH-	
	603	CH3	СНЗ	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	(СН ₃) ₂ СН-	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	

50

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	604	сн3	сн3	6-CH ₃	(СН ₃)2СН-	(сн ₃)2сн-	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
	605	СНЗ	CH3	6-CH ₃	(сн ₃) 2сн-	(сн ₃)2сн-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
15	606	CH3	CH3	6-CH3	C4H9-	н	н	C2H ₅ -	
	607	СНЗ	снз	6-CH3	C4H9-	н	н	(CH ₃) ₂ CH-	
	608	СНЗ	снз	6-CH ₃	C4H9-	Н	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
20	609	сн3	СН3	6-CH ₃	C4H9-	н	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
25	610	СНЗ	CH3	6-CH3	C4H9-	н	Н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
	611	снз	CH3	6-CH3	C4H9-	сн ₃ -	н	С ₂ н ₅ -	
	612	снз	снз	6-CH3	C4H9-	сн ₃ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
30	613	снз	снз	6-CH3	C4H9-	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
35	614	снз	сн3	6-CH ₃	С ₄ н ₉ -	сн3-	Н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
	615	сн3	CH3	6-CH3	C4H9-	СН3-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	616	снз	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-с	н2- н	H	с ₂ н ₅ -	
40	617	СНЗ	CH3	6-CH3	(сн ₃)2сн-с	н ₂ - н	H	(CH ₃) ₂ CH-	
	618	CH3	CH3	6-CH3	(CH3)2CH-C	н ₂ - н	H	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
45	619	снз	снз	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-с	н ₂ - н	H	CH ₃ CH-	
	620	снз	СН3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-с	н ₂ - н	H	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	х	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
10	621	CH3	CH3	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	сн3-	H	C ₂ H ₅ -	
	622	сн ₃	сн3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	сн3-	H	(CH ₃) ₂ CH-	
	623	CH3	CH ₃	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
15	624	сн3	сн3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	сн3-	н	сн ₃ с ₂ н ₅	
20	625	снз	CH3	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	сн3-	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
	626	сн3	снз	6-CH3	с ₂ н ₅ сн-	н	н	с ₂ н ₅ -	
25	627	сн3	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн ₃	н	н	(CH ₃) ₂ CH-	
30	628	снз	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
35	629	снз	снз	6-CH3	С ₂ Н ₅ СН-	н	н	сн ₃ с ₂ н ₅	
40	630	сн3	сн3	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	631	сн3	снз	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	СН3-	н	с ₂ н ₅ -	
45	632	снз	CH3	6-CH ₃	с ₂ н ₅ сн-	сн3-	н	(CH ₃) ₂ CH-	

55

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	633	СНЗ	снз	6-СН _З	с ₂ н ₅ сн ₃	сн3-	н	(СН3)2СН-СН2-	
15	634	снз	сн3	6-CH3	с ₂ н ₅ сн-	сн ₃ -	н	сн ₃ с ₂ н ₅	
	635	сн3	СНЗ	6-CH3	с ₂ н ₅ сн-	сн3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
20	636	CH3	CH3	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	Н	н	C ₂ H ₅ -	
	637	снз	CH3	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	H	н	(CH ₃) ₂ CH-	Öl
05	638	снз	CH3	6-CH ₃	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂	-
25	639	сн3	CH3	6-CH ₃	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	Н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
30	640	снз	снз	6-CH3	сн ₂ =сн-сн ₂ -	н	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	641	снз	сн3	6-CH ₃	<u></u> ^	н	н	с ₂ н ₅ -	
35	642	сн3	сн3	6-СН _З	<u></u> ^	н	н	(сн ₃) ₂ сн-	Ö
40	643	снз	сн3	6-СН _З	<u></u> ^	н	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
45	644	сн3	сн3	6-СН3	○ ^	н	н	СН ₃ СН- С ₂ Н ₅	
	645	сн3	сн3	6-CH3	<u>_</u> ^	н	н	(СН3)3С-СН2-	

55

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

_								
Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	C*	R ¹	Fp °C
646	CH3	CH3	6-СН _З	>	н	н	сн ₃ -	
647	СНЗ	снз	6-CH3	>	н	Н	С ₂ н ₅ -	
648	СНЗ	снз	6-CH ₃	> -	н	Н	(сн ₃) ₂ сн-	
649	сн3	снз	6-CH3	>	H	Н	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	
650	сн3	снз	6-CH3	>	н	н	с ₂ н ₅ сн-	Öl
651	снз	снз	6-CH3	>	H	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
652	снз	сн ₃	6-CH3	>	Н	н	\bigcirc	
653	снз	снз	6-CH3	>	Н	н		
654	снз	СНЗ	6-CH3	>	сн ₃ -	н	сн3-	
655	снз	снз	6-CH3	>	сн ₃ -	н	С ₂ н ₅ -	
656	снз	снз	6-CH3	D —	сн ₃ -	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
657	снз	сн3	6-CH3	>	сн3-	н	(сн ₃)2 сн-сн ₂ -	
658	СНЗ	снз	6-CH ₃	D -	СН ₃ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
659	CH3	сн3	6-CH3	>	сн3-	н	(сн ₃)3с-сн ₂ -	
660	снз	снз	6-CH3	>	сн ₃ -	Н	\bigcirc	
661	снз	сн3	6-CH3	> -	сн3-	н		

EP 0 377 893 A2

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	8	c*	R ¹	Fp °C
	662	СН3	снз	6-CH ₃	>	С ₂ Н ₅ -	Н	СН3-	
10	663	CH3	CH3	6-CH ₃	>	C ₂ H ₅ -	H	C ₂ H ₅ -	
	664	CH3	СНЗ	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	H	(CH ₃) ₂ CH-	
15	665	снз	СНЗ	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	H	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
	666	сн3	сн3	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	Öl
20	667	снз	CH3	6-CH3	> —	C2H5-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
25	668	снз	снз	6-CH3	> -	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
25	669	снз	СНЗ	6-CH3	>	с ₂ н ₅ -	н		
30	670	CH3	снз	6-CH3	D —	C ₃ H ₇ -	Н	С ₂ Н ₅ -	
	671	СНЗ	снз	6-CH ₃	>	С ₃ Н ₇ -	Н	(CH3)2CH-	
35	672	CH3	снз	6-CH ₃	>	С ₃ Н ₇ -	Н	(сн ₃)2сн-сн ₂ -	
30	673	снз	снз	6-СН ^З	>	с ₃ н ₇ -	Н	СН ₃ СН- С ₂ Н ₅	
40	674	CH3	снз	6-CH3	> -	С ₃ Н ₇ -	H	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	•
	675	CH3	СНЗ	6-CH3	>	(сн ₃)2сн-	H	с ₂ н5-	
45	676	CH3	снз	6-CH ₃	> -	(CH ₃) ₂ CH-	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
4 0	677	CH3	СНЗ	6-CH ₃	D —	(CH ₃) ₂ CH-	H	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -	•

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	678	снз	снз	6-сн3) — (сн ₃) ₂ сн-	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
	679	снз	снз	6-CH3	D — (сн ₃) ₂ сн-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
15	680	CH ³	сн3	6-CH ₃	\bigcirc	н	н	сн ₃ -	70
20	681	сн3	сн3	6-СН3	\bigcirc	н	н	С ₂ Н ₅ -	56
	682	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	H	н	(сн3)2сн-	84
25	683	сн3	снз	6-CH3	\Box	н	н	(сн3)2сн-сн5-	69
30	684	сн3	сн3	6-СН _З	\Box	н	н	с ₂ н ₅ сн- сн ₃	64 -
35	685	снз	снз	6-CH3	\Box	н	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	114
	686	снз	снз	6-СН _З	\Box	Н	н	\bigcirc	
40	687	снз	СНЗ	6-CH3	\bigcirc	Н	н	<u></u>	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	X	Y	z _n	A	В	c*	R ¹	Fp °C
10	688	снз	снз	6-CH ₃	\Box	сн ₃ -	н	сн ₃ -	
45	689	снз	снз	6-CH ₃	\Box	сн3-	Н	С ₂ н ₅ -	
15	690	сн3	снз	6-CH3	\Box	сн3-	н	(CH3)2CH-	
20	691	снз	снз	6-CH3		сн ₃ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
25	692	сн3	сн3	6-CH3	\Box	сн ₃ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
30	693	снз	снз	6-CH3	\Box	СН3-	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	694	CH ₃	снз	6-CH3		сн ₃ -	н	\bigcirc	
35	695	снз	снз	6-CH3		сн3-	н	<u></u>	
40	696	сн3	снз	6-СН _З		с ₂ н ₅ -	н	сн ₃ -	
45	697	СН3	сн3	6-CH ₃		с ₂ н ₅ -	Н	с ₂ н ₅ -	

50

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	X	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	698	снз	снз	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(СН ₃) ₂ СН-	
15	699	снз	снз	6-CH ₃	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
75	700	сн ₃	снз	6-CH ₃	\Box	С ₂ Н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
20	701	снз	сн3	6-CH ₃	\Box	с ₂ н ₅ -	н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
25	702	снз	сн3	6-CH ₃	\Box	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
30	703	снз	снз	6-CH3	\Box	с ₂ н ₅ -	н		
35	704	снз	снз	6-CH ₃	\Box	C ₃ H ₇ -	н	С ₂ Н ₅ -	
	705	снз	снз	6-CH ₃	\Box	С ₃ Н ₇ -	н	(сн ₃)2сн-	
40	706	снз	снз	6-CH ₃	\Box	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн2	-
45	707	СНЗ	СН3	6-CH ₃	\Box	С ₃ н ₇ -	н	сн ₃ сн-	
50	708	CH3	CH3	6-CH ₃	\Box	С ₃ н ₇ -	н	(СН _З) _З С-СН2	-

Tabelle 3 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	A B	c*	R ¹	Fp °C
10	709	CH3	сн ₃	6-CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-	. н	C2H ₅ -	
15	710	снз	снз	6-CH3	(CH3)2CH-	- н	(сн3) 2сн-	
	711	сн ₃	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH	- н	(сн ₃) 2сн-сн	12-
20	712	сн3	CH3	6-CH3	(сн ₃) ₂ сн	- н	СН ₃ СН- С ₂ Н ₅	
25	713	снз	снз	6-CH3	(CH ₃) ₂ CH	- н	(CH ₃)3C-CI	H2-
30	714	снз	снз	6-СН _З	— н	н	сн ₃ -	
35	715	сн ₃	сн3	6-СН _З	— н	н	С ₂ Н ₅ -	
	716	снз	сн3	6-CH ₃	— н	н	(CH3)2CH-	
40	717	сн ₃	сн3	6-CH ₃	— н	н	(сн ₃)2сн-сн	l ₂ -
45	718	сн ₃	CH3	6-СН _З	Н —	н	с ₂ н ₅ сн ₃	

50

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	719	CH3	СНЗ	6-CH3	<u></u>	Н	Н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
	720	снз	сн3	6-CH3	<u></u>	н	Н	\bigcirc	
15	721	снз	сн3	6-CH ₃	<u></u>	н	Н		
20	722	сн ³	сн3	6-CH3	<u></u>	сн ₃ -	н	сн3-	
25	723	сн ₃	снз	6-сн ₃	<u></u>	сн3-	н	С ₂ н ₅ -	
30	724	снз	снз	6-CH3	\bigcirc	сн3-	н	(сн ₃) ₂ сн-	
	725	снз	снз	6-СН _З	<u></u>	сн ₃ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
35	726	снз	снз	6-CH ₃	\bigcirc	сн ₃ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
40	727	снз	CH3	6-СН _Э	\bigcirc	сн ₃ -	н	(CH3)3C-CH2-	
45	728	сн3	СНЗ	6-СН _З	\bigcirc	сн3-	н	\bigcirc	
; 50	729	CH3	CH3	6-CH3	\bigcirc	сн ₃ -	н	\bigcirc	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	Z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp °C
10	730	сн ₃	снз	6-CH ₃	<u></u>	С ₂ н ₅ -	н	сн ₃ -	
	731	сн3	снз	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	с ₂ н ₅ -	
15	732	сн ₃	CH3	6-CH3	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(CH ₃) ₂ CH-	
20	733	снз	сн3	6-CH ₃	\bigcirc	с ₂ н ₅ -	н	(CH3)2CH-CH2	
25	734	сн ₃	снз	6-CH ₃	\bigcirc	С ₂ Н ₅ -	н	с ₂ н ₅ сн-	
30	735	сн3	СНЗ	6-CH3	<u></u>	С ₂ Н ₅ -	н	(СН ₃) ₃ С-СН ₂	; -
	736	СН _З	сн3	6-CH ₃	·	с ₂ н ₅ -	н	\bigcirc	
35	737	сн ₃	CH3	6-CH	,	с ₂ н ₅ -	н		
40	738	СН3	сн ₃	6-CH	3	С ₃ Н ₇ -	Н	C ₂ H ₅ -	
45	739	CH ₃	₃ сн _з	6-CH	3	С ₃ Н ₇ -	ŀ	н (сн ₃)2сн-	

55

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	c*	R ¹	Fp ° (
740	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	С ₃ н ₇ -	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂	:
741	сн3	снз	6-CH3	<u></u>	С ₃ н ₇ -	Н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
742	сн3	CH3	6-CH ₃	<u></u>	с ₃ н ₇ -	н	(сн ₃)3с-сн	2-
743	снз	сн3	6-CH3	\bigcirc	(CH ₃) ₂ CH-	н	С ₂ н ₅ -	
744	снз	снз	6-СН _З	\bigcirc	(СН ₃) ₂ СН-	н	(СН ₃) ₂ СН-	
745	CH3	сн3	6-CH3	\bigcirc	(CH ₃) ₂ CH-	н	(сн ₃) ₂ сн-сн	2
746	снз	снз	6-CH3	\bigcirc	(сн ₃) ₂ сн-	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
747	СН3	CH ₃	6-CH ₃	\bigcirc	(сн ₃) ₂ сн-	н	(сн ₃)3с-сн	12-
748	CH3	СНЗ	6-CH ₃	CH3-0-(C	H ₂) ₂ - н	Н	с ₂ н ₅ -	
749	снз	CH3	6-CH3	CH3-0-(C	н ₂) ₂ - н	Н	(CH ₃)2CH-	
750	CH3	CH3	6-CH3	CH3-0-(C	H ₂) ₂ - H	H	(CH ₃) ₂ CH-CF	¹ 2
751	СНЗ	снз	6-CH ₃	CH3-0-(C	н ₂) ₂ - н	н	сн ₃ с ₂ н ₅	

<u>Tabelle 3</u> (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	x	Y	z _n	λ	В	C*	: R ¹	Fp °C
	752	CH3	CH3	6-CH3	CH ₃ -0-(CH ₂) ₂ -	н	н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
10	753	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн ₃ -о-(сн ₂) ₂ -	сн3-	H	C2H5-	
	754	CH3	CH3	6-CH3	CH3-0-(CH2)2-	сн3-	Н	(CH ₃) ₂ CH-	
15	755	снз	CH3	6-CH3	CH3-0-(CH2)2-	сн3-	Н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	57
15	756	сн3	снз	6-CH3	CH3-0-(CH2)2-	сн ₃ -	н	сн ₃ сн-	54
20	757	снз	CH3	6-CH3	CH3-0-(CH2)2-	сн3-	Н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	
	758	снз	СНЗ	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- H	H	с ₂ н ₅ -	60
	759	CH3	CH3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃	у)- н	H	(сн ₃) ₂ сн-	
25	760	CH3	СНЗ	6-CH ₃	сн3-о-сн5-сн(сн3)- H	н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
30	761	снз	CH3	6-CH ₃	сн3-о-сн5-сн(сн3)- H	Н	СН ₃ Сн- С ₂ Н ₅	·
	762	СНЗ	CH3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃)- H	Н	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	
	763	снз	CH ₃	6-CH3	сн3-о-сн5-сн(сн3)- CH ₃ -	Н	С ₂ Н ₅ -	
35	764	СНЗ	снз	6-CH3	сн3-о-сн5-сн(сн3)- CH ₃ -	Н	(CH3)SCH-	
	765	CH3	CH3	6-CH3	сн3-о-сн5-сн(сн3)- CH ₃ -	Н	(сн ₃) ₂ сн-сн ₂ -	
40	766	сн3	сн3	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃	3)- CH3-	н	сн ₃ сн- с ₂ н ₅	
45	767	СНЗ	СНЗ	6-CH3	сн ₃ -о-сн ₂ -сн(сн ₃	₃)- сн ₃ -	- н	(сн ₃) ₃ с-сн ₂ -	•

Herstellung der Zwischenprodukte

Beispiel I

55

11,25 g (0,15 Mol) Sarkosin und 3 g (0,075 Mol) NaOH werden in 210 ml Wasser gelöst. Unter Wasserbadkühlung werden 9 g (0,225 Mol) NaOH, gelöst in 45 ml Wasser, und 29,6 g (0,15 Mol Mesitylenessigsäurechlorid synchron zugetropft, wobei die Temperatur auf < 40°C gehalten wird. Nach 1 Stunde säuert man bei 0 bis 20°C mit konz. HCl, saugt ab und trocknet im Vakuum bei 70°C über P₂O₅. Es werden 37,1 g (99,3 % der Theorie N-(2.4.6-Trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin vom Schmelzpunkt 140°C erhalten.

Beispiel II

5

15

20 H₃C N CH₃ CH₃
CH₃ CH₃

37,1 g (0,149 Mol) N-(2.4.6-Trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin werden in 150 ml Methanol suspendiert, mit 22 ml (0,165 Mol) Dimethoxypropan versetzt und nach Zugabe von 1,43 g (7,5 mmol) p-Toluolsulfonsäure-monohydrat 3 Stunden unter Rückfluß erhitzt.

Nach Abdampfen des Lösungsmittels wird der Rückstand in CH₂Cl₂ aufgenommen, mit Bicarbonatlösung gewaschen, getrocknet und einrotiert. Man erhält 34 g (ca. 86,7% der Theorie) N-(2.4.6-Trimethylphenyl-acetyl)-sarkosin-methylester als hellgelbes Öl.

¹H-NMR(200 MHz, CDCl₃):

 δ = 2,18, 2,2, 2,28 (s, 9H Ar-CH₃); 3,0, 3,2 (s, 3H, NCH₃), 3,64, 3,67 (s, 2H, CH₂-Ar), 3,66, 3,69 (s, 3H, OCH₃), 3,79, 4,14 (s, 2H, N-CH₂-CO), 6,82 (s, 2H, Ar 3-H, 5-H)

Beispiel III

40

45

50

17,4 g (0,12 Mol) N-Isopropylglycin-ethylester werden in 180 ml abs. THF gelöst und mit 16,8 ml (0,12 Mol) Triethylamin versetzt. Bei 0 - 10° C werden 26,82 g (0,12 Mol) 2.6-Dichlorphenylessigsäurechlorid in 20 ml abs. THF zugetropft. Nach 1 Stunde rührt man in 1 l Eiswasser + 100 ml 1 NHCl ein, extrahiert mit CH₂Cl₂, trocknet und engt ein. Es werden 36,8 g (89,1 % der Theorie) eines gelben Öls erhalten.

¹H-NMR(200 MHz, CDCl₃):

 δ = 1,11 - 1,32 (m, 9H CH₂-CH₃ CH(CH₃)₂), 7,08 - 7,15 (1H, m, Ar 4-H), 7,25 - 7,32 (m, 2H, Ar-3-H, 5-H). Die Wirkstoffe eignen sich zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, vorzugsweise Arthropoden und

Nematoden, insbesondere Insekten und Spinnentieren, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

- 5 Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.
 - Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus.
 - Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spec.
 - Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.
 - Aus der Ordnung der Thysanura z.B. Lepisma saccharina.
- 10 Aus der Ordnung der Collembola z.B. Onychiurus armatus.
 - Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica, Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus differentialis, Schistocerca gregaria.
 - Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.
- 5 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Reticulitermes spp..
 - Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp.
 - Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. Trichodectes spp., Damalinea spp.
 - Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci.
- Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp.
 - Aus der Ordnung der Homoptera z.B. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Aphis fabae, Doralis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix cincticeps, Lecanium comi, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus,
- Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp. Psylla spp.
 - Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella maculipennis, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp. Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia
- spp., Earias insulana, Heliothis spp., Spodoptera exigua, Mamestra brassicae, Panolis flammea, Prodenia litura, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana.
- Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Acanthoscelides obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp.,
- Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica.
 - Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.
- Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa.
 - Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..
- Aus der Ordnung der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.
 - Aus der Ordnung der Acarina z.B. Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp..
 - Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp..
 - Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können weiterhin als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel

und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Charakteristisch für die erfindungsgemäßen Verbindungen ist, daß sie eine selektive Wirksamkeit gegen monokotyle Unkräuter im Vor- und Nachlaufverfahren (Pre- und Postemergence) bei guter Kulturflanzenverträglichkeit aufweisen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca,

Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Dabei zeigen die erfindungsgemäßen Wirkstoffe neben einer hervorragenden Wirkung gegen Schadpflanzen gute Verträglichkeit gegenüber wichtigen Kulturpflanzen, wie z. B. Weisen, Baumwolle, Sojabohnen, Citrusfrüchten und Zuckerrüben, und können daher als selektive Unkrautbekämpfungsmittel eingesetzt werden.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe, Feinstverkapselungen in polymeren Stofen und in Hüllmassen für Saatgut, ferner in Formulierungen mit Brennsätzen, wie Räucherpatronen, -dosen, -spiralen u.ä., sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser; mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gerneint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgas, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid; als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate; als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel; als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-50 Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykol-Ether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von

Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akariziden, Nematiziden Herbiziden oder Fungiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Die erfindungsgemäß verwendbaren Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Milben, Zecken usw. auf dem Gebiet der Tierhaltung und Viehzucht, wobei durch die Bekämpfung der Schädlinge bessere Ergebnisse, z.B. höhere Milchleistungen, höheres Gewicht, schöneres Tierfell, längere Lebensdauer usw. erreicht werden können.

Die Anwendung der erfindungsgemäß verwendbaren Wirkstoffe geschieht auf diesem Gebiet in bekannter Weise wie durch orale Anwendung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Granulaten, durch dermale bzw. äußerliche Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens (Dippen), Sprühens (Sprayen), Aufgießens (pour-on and spot-on) und des Einpuderns sowie durch parenterale Anwendung in Form beispielsweise der Injektion sowie ferner durch das "feed-through"-Verfahren. Daneben ist auch eine Anwendung als Formkörper (Halsband, Ohrmarke) möglich.

Beispiel A

30

Nephotettix-Test

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Reiskeimlinge (oryza sativa) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven der Grünen Reiszikade (Nephotettix cincticeps) besetzt, solange die Keimlinge noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Zikaden abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Zikaden abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik: (5), (54), (55), (56), (57), (58).

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) weisen antimikrobielle, insbesondere starke antibakterielle und antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sproßpilze sowie biphasische Pilze, z.B. gegen Candida-Arten wie Candida albicans, Epidermophyton-Arten wie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Arten wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Arten wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Arten wie Microsporon felineum sowie Torulopsis-Arten wie Torulopsis glabrata. Die Aufzählung dieser Mikroorganismen stellt keinesfalls eine Beschränkung der bekämpfbaren Keime dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Als Indikationsbeispiele in der Humanmedizin können beispielsweise genannt werden:

Dermatomykosen und Systemmykosen durch Trichophyton mentagrophytes und andere Trichophytonarten, Microsporonarten sowie Epidermophyton floccosum, Sproßpilze und biphasische Pilze sowie Schimmelpilze hervorgerufen.

Als Indikationsgebiet in der Tiermedizin können beispielsweise aufgeführt werden:

Alle Dermatomykosen und Systemmykosen, insbesondere solche, die durch die obengenannten Erreger hervorgerufen werden.

Zur vorliegenden Erfindung gehören pharmazeutische Zubereitungen, die neben nicht toxischen, inerten pharmazeutisch geeigneten Trägerstoffen einen oder mehrere erfindungsgemäße Wirkstoffe enthalten oder die aus einem oder mehreren erfindungsgemäßen Wirkstoffen bestehen.

Zur vorliegenden Erfindung gehören auch pharmazeutische Zubereitungen in Dosierungseinheiten. Dies bedeutet, daß die Zubereitungen in Form einzelner Teile, z.B. Tabletten, Dragees, Kapseln, Pillen, Suppositorien und Ampullenvorliegen, deren Wirkstoffgehalt einen Bruchteil oder einem Vielfachen einer Einzeldosis entspricht. Die Dosierungseinheiten können z.B. 1,2,3 oder 4 Einzeldosen oder 1/2, 1/3 oder 1/4 einer Einzeldosis enthalten. Eine Einzeldosis enthält vorzugsweise die Menge Wirkstoff, die bei einer Applikation verabreicht wird und die gewöhnlich einer ganzen, einer halben oder einem Drittel oder einem Viertel einer Tagesdosis entspricht.

Unter nicht toxischen, inerten pharmazeutisch geeigneten Trägerstoffen sind feste, halbfeste oder flüssige Verdünnungsmittel, Füllstoffe oder Formulierungshilfsmittel jeder Art zu verstehen.

Als bevorzugte pharmazeutische Zubereitungen seien Tabletten, Dragees, Kapseln, Pillen, Granulate, Suppositorien, Lösungen, Suspensionen und Emulsionen, Pasten, Salben, Gele, Cremes, Lotions, Puder oder Sprays genannt.

Tabletten, Dragees, Kapseln, Pillen und Granulate können den oder die Wirkstoffe neben den üblichen Trägerstoffen enthalten, wie (a) Füll- und Streckmittel, z.B. Stärken, Milchzucker, Rohrzucker, Glucose, Mannit und Kieselsäure re, (b) Bindemittel, z.B. Carboxymethylcellulose, Alginate, Gelantine, Polyvinylpyrrolidon, (c) Feuchthaltemittel, z.B. Glycerin, (d) Sprengmittel, z.B. Agar-Agar, Calciumcarbonat und Natriumbicarbonat, (e) Lösungsverzögerer, z.B. Paraffin und (f) Resorptionsbeschleuniger, z.B. quarternäre Ammoniumverbindungen, (g) Netzmittel, z.B. Cetylalkohol, Glycerinmonostearat, (h) Adsorptionsmittel, z.B. Kaolin und Bentonit und (i) Gleitmittel, z.B. Talkum, Calcium- und Magnesiumstearat und feste Polyethylenglykole oder Gemische der unter (a) bis (i) aufgeführten Stoffe.

Die Tabletten, Dragees, Kapseln, Pillen und Granulate können mit den üblichen gegebenenfalls Opakisierungsmittel enthaltenden Überzügen und Hüllen versehen sein und so zusammengesetzt sein, daß sie den oder die Wirkstoffe nur oder bevorzugt in einem bestimmten Teil des Intestinaltraktes, gegebenenfalls verzögert abgeben, wobei als Einbettungsmassen z.B. Polymersubstanzen und Wachse verwendet werden können.

Der oder die Wirkstoffe können gegebenenfalls mit einem oder mehreren der oben angegebenen Trägerstoffe auch in mikroverkapselter Form vorliegen.

Suppositorien können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen wasserlöslichen oder wasserunlöslichen Trägerstoffe enthalten, z.B. Polyethylenglykole, Fette, z.B. Kakaofett und höhere Ester (z.B. C₁₄-Alkohol mit C₁₅-Fettsäure) oder Gemische dieser Stoffe.

Salben, Pasten, Cremes und Gele können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen Trägerstoffe enthalten, z.B. tierische und pflanzliche Fette, Wachse, Paraffine, Stärke, Tragant, Cellulosederivate, Polyethylenglykole, Silicone, Bentonite, Kieselsäure, Talkum und Zinkoxid oder Gemische dieser Stoffe.

Puder und Sprays können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen Trägerstoffe enthalten, z.B. Milchzucker, Talkum, Kieselsäure, Aluminiumhydroxid, Calciumsilikat und Polyamidpulver oder Gemische dieser Stoffe, Sprays können zusätzlich die üblichen Treibmittel z.B. Chlorfluorkohlenwasserstoffe enthalten.

Lösungen und Emulsionen können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen Trägerstoffe wie Lösungsmittel, Lösungsverzögerer und Emulgatoren, z.B. Wasser, Ethylalkohol, Isopropylalkohol, Ethylcarbonat, Ethylacetat, Benzylalkohol, Benzylbenzoat, Propylenglykol, 1,3-Buty lenglykol, Dimethylformamid, Öle, insbesondere Baumwollsaatöl, Erdnußöl, Maiskeimöl, Olivenöl, Ricinusöl und Sesamöl, Glycerin, Glycerinformal, Tetrahydrofurfurylalkohol, Polyethylenglykole und Fettsäureester des Sorbitans oder Gemische dieser Stoffe enthalten.

Zur parenteralen Applikation können die Lösungen und Emulsionen auch in steriler und blutisotonischer Form vorliegen.

Suspensionen können neben dem oder den Wirkstoffen die üblichen Trägerstoffe, wie flüssige Verdünnungsmittel, z.B. Wasser, Ethylalkohol, Propylalkohol, Suspendiermittel, z.B. ethoxylierte Isostearylalkohole, Polyoxyethylensorbit- und -sorbitanester, mikrokristalline Cellulose, Aluminiummetahydroxid, Bentonit, Agar-Agar und Tragant oder Gemische dieser Stoffe enthalten.

Die genannten Formulierungsformen können auch Färbemittel, Konservierungsstoffe sowie geruchsund geschmacksverbessernde Zusätze, z.B. Pfefferminzöl und Eukalyptusöl und Süßmittel, z.B. Saccharin enthalten.

Die therapeutisch wirksamen Verbindungen sollen in den oben angeführten pharmazeutischen Zubereitungen vorzugsweise in einer Konzentration von etwa 0,1 bis 99,5, vorzugsweise von 0,5 bis 95 Gew.-% der

Gesamtmischung vorhanden sein.

Die oben aufgeführten pharmazeutischen Zubereitungen können außer den erfindungsgemäßen Wirkstoffen auch weitere pharmazeutische Wirkstoffe enthalten.

Die Herstellung der oben aufgeführten pharmazeutischen Zubereitungen erfolgt in üblicher Weise nach bekannten Methoden, z.B. durch Mischen des oder der Wirkstoffe mit dem oder den Trägerstoffen.

Zur vorliegenden Erfindung gehört auch die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe, sowie von pharmazeutischen Zubereitungen, die einen oder mehrere erfindungsgemäße Wirkstoffe enthalten, in der Human- und Veterinärmedizin zur Verhütung, Besserung und/oder Heilung der oben aufgeführten Erkrankungen.

Die Wirkstoffe oder die pharmazeutischen Zubereitungen können lokal, oral, parenteral, intraperitoneal und/oder rektal, vorzugsweise parenteral, insbesondere intravenös appliziert werden.

Im allgemeinen hat es sich sowohl in der Human- als auch in der Veterinärmedizin als vorteilhaft erwiesen, den oder die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Gesamtmengen von etwa 2,5 bis etwa 200, vorzugsweise von 5 bis 150 mg/kg Körpergewicht je 24 Stunden, gegebenenfalls in Form mehrerer Einzelgaben zur Erzielung der gewünschten Ergebnisse zu verabreichen.

Bei oralen Applikationen werden die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Gesamtmengen von etwa 2,5 bis etwa 200, vorzugsweise von 5 bis 150 mg/kg Körpergewicht je 24 Stunden und bei parenteraler Applikation in Gesamtmengen von etwa 2,5 bis etwa 50, vorzugsweise von 1 bis 25 mg/kg Körpergewicht je 24 Stunden verabreicht.

Es kann jedoch erforderlich sein, von den genannten Dosierungen abzuweichenund zwar in Abhängigkeit von der Art und dem Körpergewicht des zu behandelnden Objektes, der Art und Schwere der Erkrankung, der Art der Zubereitung und der Applikation des Arzneimittels sowie dem Zeitraum bzw. Intervall, innerhalb welchem die Verabreichung erfolgt. So kann es in einigen Fällen ausreichend sein, mit weniger als der obengenannten Menge Wirkstoff auszukommen, während in anderen Fällen die oben angeführte Wirkstoffmenge überschritten werden muß. Die Festlegung der jeweils erforderlichen optimalen Dosierung und Applikationsart der Wirkstoffe kann durch jeden Fachmann aufgrund seines Fachwissens leicht erfolgen.

30 Beispiel B

35

10

Antimykotische in-vitro-Wirksamkeit

Versuchsbeschreibung:

Die in-vitro-Prüfungen wurden mit Keiminokula von durchschnittlich 1 x 10⁴ Keimen/ml Substrat durchgeführt. Als Nährmedium diente Yeast Nitrogen Base-Medium für Hefen und Kimmig-Medium für Schimmelpilze und Dermatophyten.

Die Bebrütungstemperatur betrug 37 °C bei Hefen und 28 °C bei Schimmelpilzen und Dermatophyten, die Bebrütungsdauer lag bei 24 bis 96 Stunden bei Hefen und 96 bis 120 Stunden bei Dermatophyten und Schimmelpilzen.

Die Beurteilung der Fungizide erfolgt durch Ausplattieren und erneutes Bebrüten voll gehemmter Ansätze, wobei fungizide Konzentrationen weniger als 100 Keime c.f.n. (colony forming unit) pro ml enthalten.

In diesem Test zeigen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) gemäß den Herstellungsbeispielen 45, 46, 47 eine stark ausgeprägte antimykotische Wirksamkeit.

Ansprüche

1. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I)

55

$$\begin{array}{c|c}
C^* & R-O & X \\
\hline
A-N & O
\end{array}$$

in welcher

5

10

X für Alkvl, Halogen, Alkoxy steht,

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R¹, -CO-O-R² steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes tes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyal-

kvl steht und

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

2. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

X für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

30 Y für Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, Halogen, C1-C6-Alkoxy, C1-C3-Halogenalkyl steht,

Z für C₁-C₆-Alkyl, Halogen, C₁-C₆-Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R² (lc)

steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl und Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C₁-C₆-Alkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl;

für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy-, C₁-C₆-Halogenalkyl-, C₁-C₆-Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₆-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C6-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen, Amino und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C1-C6-Alkyl steht,

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes: C₁-C₂₀-Alkyl, C₂-C₂₀-Alkenyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C_1 - C_6 -Alkyl-, C_1 - C_6 -Alkoxy-, C_1 - C_6 -Halogenalkyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₁-C₁₀-Alkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₈-Polyalkoxy-C₂-C₈-alkyl, C₁-C₁₀-Alkylthio-C₂-C ₈-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C₁-C₆-Alkyl-C₁-C ₆-Haloalkyl-, C₁-C₆-Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl-C₁-C₆-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

- 3. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivat der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
- X für C1-C4-Alkyl, Halogen, C1-C4-Alkoxy steht,
- Y für Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, Halogen, C1-C4-Alkoxy, C1-C2-Halogenalkyl steht,
- Z für C₁-C₄-Alkyl, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,
 - R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R2 (Ic

steht, in welchen

für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl und Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,

für gegebenenfalls durch Halogen-, Nitro-, C_1 - C_4 -Alkyl-, C_1 - C_4 -Alkoxy-, C_1 - C_3 -Halogenalkyl-, C_1 - C_3 -Halogenalkoxy-substituiertes Phenyl steht,

15 für gegebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Alkoxy-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₃-Halogenalkyl-, C₁-C₄-alkyl steht,

für gegebenenfalls duch Halogen- und C1-C6-Alkyl-substituiertes Hetaryl steht,

gegebenenfalls für durch Halogen- und C1-C4-Alkyl-substituiertes Phenoxy-C1-C5-alkyl steht,

für gegebenfalls durch Halogen, Amino und C1-C4-Alkyl-substituiertes Hetaryloxy-C1-C5-alkyl steht,

Figure 1. Für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C₁-C₁₆-Alkyl, C₂-C₁₆-Alkenyl, C₁-C₁₆-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, Steht,

für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro-, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy-, C_1 - C_3 -Halogenalkyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₃-C₆-25 Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₆-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₂-C₆-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann oder geebenenfalls durch Halogen-, C₁-C₄-Alkyl-, C₁-C₄-Halogenalkyl-C₁-C₄-Alkoxy-, Nitro substituiertes Aryl-C₁-C₄-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₀-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

- 4. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
- für Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
- Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy und Trifluormethyl steht,
 - Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy und Ethoxy steht,
 - n für eine Zahl von 0-3 steht,
 - R für Wasserstoff (la) oder für die Gruppen der Formel

-CO-R1 (lb)

oder -CO-O-R² (Ic)

steht, in welcher

für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes: C_1-C_{14} -Alkyl, C_2-C_{14} -Alkenyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_2-C_6 -alkyl, C_1-C_4 -Alkylthio- C_2-C_6 -alkyl, C_1-C_4 -Polyalkoxyl- C_2-C_4 -alkyl und Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl-, Trifluormethoxy-, Nitro- substituiertes Phenyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluor-methyl, Trifluormethoxy-substituiertes Phenyl-C₁-C₃-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Pyridyl, Pyrimidyl, Thiazolyl sound Pyrazolyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Methyl-, Ethyl-substituiertes Phenoxy-C1-C4-alkyl steht,

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Amino-, Methyl-, Ethyl-, substituiertes Pyridyloxy-C₁-C₄-alkyl, Pyrimidyloxy-C₁-C₄-alkyl und Thiazolyloxy-C₁-C₄-alkyl steht,

R² für gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₁₄-Alkyl, C₂-C₁₄-Alkenyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkyl, C₁-C₄-Polyalkoxy-C₂-C₆-alkyl steht

oder

für gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Nitro-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, i-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Ringatomen steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₆-Alkylthio-C₂-C₄-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff-und/oder Schwefelatomen unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluormethyl-, Nitro susbtituiertes Aryl-C₁-C₃-alkyl steht,

B, C unabhängig voneinander für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxyalkyl steht,

sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel I.

5. Verfahren zur Herstellung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten der allgemeinen Formel (I)

in welcher

10

15

25

40

50

X für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

20 Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl steht,

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

R für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R¹, -CO-O-R² steht, in welchen

R¹ für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl. Polyalkoxyalkyl und Cycloalkyl, das durch Heteroatome unterbrochen sein kann, gegebenenfalls subst. Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl, substituiertes Hetaryl, substituiertes Phenoxyalkyl und substituiertes Hetaryloxyalkyl steht und

R² für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Cycloalkyl steht,

A für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Haloalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,

B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy steht,

dadurch gekennzeichnet,

(A) daß man zum Erhalt der Verbindungen der Formel (la)

N-Acylaminosäureester der Formel (II)

s in welcher

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben und

R3 für Alkyl steht,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart einer Base intramolekular kondensiert, (B) oder, daß man zum Erhalt von Verbindungen der Formel (Ib)

(Ib)

Verbindungen der Formel (la).

15

$$\begin{array}{c|cccc}
& C^* & HO & X \\
& & & & Z_n \\
& & & & & Y
\end{array}$$
(Ia)

20

5

10

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben, entweder

α)mit Säurehalogeniden der allgemeinen Formel (III)

C -R1 Hal-

in welcher

in welcher

die oben angegebene Bedeutung hat R١

30 und

für Halogen, insbesondere Chlor und Brom steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

oder

B) mit Carbonsäureanhydriden der allgemeinen Formel (IV)

R1-CO-O-CO-R1 (IV)

die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels,

umsetzt,

45

50

(C) oder, daß man zum Erhalt von Verbindungen der Formel (Ic)

(Ic)

in welcher

A, B, C*, X, Y, Z, R² und n die oben angegebene Bedeutung haben,

Verbindungen der Formel (la)

in welcher

5

A, B, C*, X, Y, Z und n die oben angegebene Bedeutung haben mit Chlorameisensäureester der allgemeinen Formel (V)

R2-O-CO-CI (V)

in welcher

R² die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfals in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

- 6. Insektizide und/oder akarizide und/oder herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivat der Formel (I).
- 7. Verfahren zur Bekämpfung von Insekten und/oder Spinnentieren und/oder Unkräutern, dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) auf Spinnentiere und/oder Unkräutern und/oder deren Lebensraum einwirken läßt.
- 8. Verwendung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten der Formel (I) zur Bekämpfung von Insekten und/oder Spinnentieren und/oder Unkräutern.
- 9. Verfahren zur Herstellung von insektiziden und/oder akariziden und/oder herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.
 - 10. 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gemäß Ansprüchen 1 bis 4 zur Bekämpfung von Mykosen.
 - 11. Antimykotische Mittel enthaltende 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gemäß Ansprüchen 1 bis 4.
- 12. Verwendung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten gemäß Ansprüchen 1 bis 4 bei der Bekämpfung von Mykosen.
- 13. Verwendung von 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivaten gemäß Ansprüchen 1 bis 4 bei der Herstellung von Arzneimitteln zur Bekämpfung von Mykosen.

35

30

40

45

50

œ

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 89123895.8

2 Anmeldetag: 23.12.89

(i) Int. Cl.5: **C07D 207/38**, C07D 405/12, A01N 43/36

Priorität: 07.01.89 DE 3900301 18.08.89 DE 3927222

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung: 18.07.90 Patentblatt 90/29

Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE ES FR GB IT LI NL

 Veröffentlichungstag des später veröffentlichten Recherchenberichts: 24.04.91 Patentblatt 91/17

(7) Anmelder: BAYER AG

W-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

Erfinder: Fischer, Reiner, Dr. Nelly-Sachs-Strasse 23 W-4019 Monheim(DE) Erfinder: Baasner, Bernd, Dr.

Wagner-Strasse 23

W-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE) Erfinder: Hagemann, Hermann, Dr.

Kandinsky-Strasse 52 W-5090 Leverkusen 1(DE) Erfinder: Krebs, Andreas, Dr.

Im Gartenfeld 70

W-5068 Odenthal-Holz(DE) Erfinder: Marhold, Albrecht, Dr. Carl-Duisberg-Strasse 329 W-5090 Leverkusen(DE)

Erfinder: Santel, Hans-Joachim, Dr.

Grünstrasse 9a

W-5090 Leverkusen(DE)

Erfinder: Schmidt, Robert R., Dr.

Im Waldwinkel 110

W-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE)

Erfinder: Lürssen, Klaus, Dr. August-Kierspel-Strasse 145 W-5060 Bergisch-Gladbach 2(DE) Erfinder: Becker, Benedikt, Dr.

Steinmannhof

I-39050 Pineta di Laives Bolzano(IT)

Erfinder: Schaller, Klaus, Dr. Am Sonnenschein 38 W-5600 Wuppertal 1(DE) Erfinder: Strang, Harry, Dr.

Heiderweg 53

W-4000 Düsseldorf 31(DE)

(4) 3-Aryl-pyrrolldin-2,4-dion-Derivate.

(37) Es werden neue 3-Aryl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I)

$$\begin{array}{c|c}
C^{*} R-O & X \\
\hline
A-N & O
\end{array}$$

in welcher

für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Υ

Halogenalkyl steht,

für Alkyl, Halogen, Alkoxy steht,

für eine Zahl von 0-3 steht,

für Wasserstoff oder für die Gruppen -CO-R1, -CO-O-R2

steht,

wobei R1 und R2 die im Anmeldungstext angegebene Bedeutung besitzen,

für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Arylalkyl steht,

B, C* unabhängig voneinander für Wasserstoff,

Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, sowie die enantiomerenreinen Formen von Verbindungen der Formel (I).

Die neuen Verbindungen besitzen eine überraschende insektizide, akarizide, herbizide und antimykotische Wirksamkeit.





EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

EP 89 12 3895

	EINSCHLÄGIG	E DOKUMENTE							
Kategorie	Kennzeichnung des Dokume der maßgeblie	nts mit Angabe, soweit erforderlich, ben Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl.5)					
X,D	EP-A-0 262 399 (TA * Tabelle 7; Ansprü	KEDA) che 1,3 *	1	C 07 D 207/38 C 07 D 405/12					
Х,О	Weinheim, DE; R. SC "Cyclisierung von NN-Acvlalycinestern"	agsgesellschaft mbH, HMIERER et al.:	1,5	A 01 N 43/36					
				RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. Cl.5)					
				C 07 D 207/00					
	·								
Der ve	orliegende Recherchenbericht wur	ie für alle Patentansprüche erstellt							
DI	Recherchenort EN HAAG	Abschindestum der Recherche 13-02-1991	KIS	Profer SLER B.E.					
X : voi Y : voi	KATEGORIE DER GENANNTEN i besonderer Bedeutung allein betrach besonderer Bedeutung in Verbindun ieren Veröffentlichung derselben Kat- huologischer Hintergrund	E: ätteres Pater tet nach dem A ; mit einer D: in der Anme	ng zugrunde liegende ntdokument, das jedo nmeldedatum veröffe eldung angeführtes Gründen angeführtes	ntlicht worden ist okument					
O: nic	chtschriftliche Offenbarung	O: nlichtschriftliche Offenbarung &: Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes P: Zwischenliteratur Dokument							

EPO FORM 1503 03.12 (PO403)